

JP2003171370A

2003-6-20

## Bibliographic Fields

## Document Identity

(19)【発行国】

日本国特許庁(JP)

(12)【公報種別】

公開特許公報(A)

(11)【公開番号】

特開2003-171370(P2003-171370  
A)

(43)【公開日】

平成15年6月20日(2003. 6. 20)

(19) [Publication Office]

Japan Patent Office (JP)

(12) [Kind of Document]

Unexamined Patent Publication (A)

(11) [Publication Number of Unexamined Application]

Japan Unexamined Patent Publication 2003- 171370 (P2003-  
171370A)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 15\*June 20\* (2003.6.20)

## Public Availability

(43)【公開日】

平成15年6月20日(2003. 6. 20)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 15\*June 20\* (2003.6.20)

## Technical

(54)【発明の名称】

ヘテロ環イミノ芳香族化合物および農園芸用殺  
菌剤

(51)【国際特許分類第7版】

C07D277/42

A01N 43/28

43/40 101

43/50

43/54

43/56

43/653

43/713

43/78

101

C07D327/04

409/12

411/12

417/12

【FI】

C07D277/42

A01N 43/28

(54) [Title of Invention]

**HETEROCYCLIC RING IMINO AROMATIC  
COMPOUND AND HORTICULTURAL MICROBICIDE**

(51) [International Patent Classification, 7th Edition]

C07D277/42

A01N 43/28

43/40 101

43/50

43/54

43/56

43/653

43/713

43/78

101

C07D327/04

409/12

411/12

417/12

[FI]

C07D277/42

A01N 43/28

43/40 101 C

43/40 101 C

43/50 C

43/50 C

F

F

43/54 B

43/54 B

Z

Z

43/56 A

43/56 A

43/653 N

43/653 N

43/713

43/713

43/78 F

43/78 F

101

101

C07D327/04

C07D327/04

409/12

409/12

411/12

411/12

417/12

417/12

【請求項の数】

[Number of Claims]

9

9

【出願形態】

[Form of Application]

OL

OL

【全頁数】

[Number of Pages in Document]

131

131

【テーマコード(参考)】

[Theme Code (For Reference)]

4C0234C0334C0634H011

4C0234C0334C0634H011

【F ターム(参考)】

[F Term (For Reference)]

4C023 AA03 4C033 AC04 AC17 4C063 AA01  
BB09 CC62 CC87 CC92 CC97 DD12 DD22  
DD25 DD29 DD41 DD47 DD87 EE03 4H011  
AA01 BB08 BB09 BB10 DA02 DA15 DA16  
DD03

4C023 AA03 4C033 AC04 AC17 4C063 AA01 BB09 CC62  
CC87 CC92 CC97 DD12 DD22 DD25 DD29 DD41 DD47  
DD87 EE03 4H011 AA01 BB08 BB09 BB10 DA02 DA15  
DA16 DD03

**Filing**

【審査請求】

[Request for Examination]

未請求

Unrequested

(21)【出願番号】

(21) [Application Number]

特願2002-184842(P2002-184842)

Japan Patent Application 2002- 184842 (P2002- 184842)

(22)【出願日】

(22) [Application Date]

平成14年6月25日(2002. 6. 25)

Heisei 14\*June 25\* (2002.6.25)

**Foreign Priority**

(31)【優先権主張番号】

特願2001-193535(P2001-193535)

(32)【優先日】

平成13年6月26日(2001. 6. 26)

(33)【優先権主張国】

日本(JP)

(31)【優先権主張番号】

特願2001-299551(P2001-299551)

(32)【優先日】

平成13年9月28日(2001. 9. 28)

(33)【優先権主張国】

日本(JP)

(31) [Priority Application Number]

Japan Patent Application 2001- 193535 (P2001- 193535)

(32) [Priority Date]

Heisei 13\*June 26\* (2001.6.26)

(33) [Priority Country]

Japan (JP)

(31) [Priority Application Number]

Japan Patent Application 2001- 299551 (P2001- 299551)

(32) [Priority Date]

Heisei 13\*September 28\* (2001.9.28)

(33) [Priority Country]

Japan (JP)

**Parties****Applicants**

(71)【出願人】

【識別番号】

000003986

【氏名又は名称】

日産化学工業株式会社

【住所又は居所】

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(71) [Applicant]

[Identification Number]

000003986

[Name]

**NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD. (DB 69-054-4069)**

[Address]

Tokyo Chiyoda-ku Kandanishikicho 3-7-1

**Inventors**

(72)【発明者】

【氏名】

仁木 俊夫

【住所又は居所】

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社物質科学研究所内

(72) [Inventor]

[Name]

Niki Toshio

[Address]

Chiba Prefecture Funabashi City Tsuboi-cho 772-1 Nissan Chemical Industries, Ltd. (DB 69-054-4069) substance science research laboratory \*

(72)【発明者】

【氏名】

水越 隆司

【住所又は居所】

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社物質科学研究所内

(72) [Inventor]

[Name]

\*\* Takashi

[Address]

Chiba Prefecture Funabashi City Tsuboi-cho 772-1 Nissan Chemical Industries, Ltd. (DB 69-054-4069) substance

株式会社物質科学研究所内

science research laboratory \*

(72)【発明者】

(72) [Inventor]

【氏名】

[Name]

井尾 知明

\*\* Tomoaki

【住所又は居所】

[Address]

千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社物質科学研究所内

Chiba Prefecture Funabashi City Tsuboi-cho 772-1 Nissan Chemical Industries, Ltd. (DB 69-054-4069) substance science research laboratory \*

(72)【発明者】

(72) [Inventor]

【氏名】

[Name]

鈴木 博之

Suzuki Hiroyuki

【住所又は居所】

[Address]

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内

Saitama Prefecture Minami Saitama-gun Shiraokamachi Oaza Shiraoka 1470 Nissan Chemical Industries, Ltd. Bioscience Research Laboratory (DB 70-627-6854) \*

(72)【発明者】

(72) [Inventor]

【氏名】

[Name]

早坂 史生

Hayasaka Fumio

【住所又は居所】

[Address]

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内

Saitama Prefecture Minami Saitama-gun Shiraokamachi Oaza Shiraoka 1470 Nissan Chemical Industries, Ltd. Bioscience Research Laboratory (DB 70-627-6854) \*

**Abstract**

(57)【要約】

(57) [Abstract]

【課題】

[Problems to be Solved by the Invention]

新規農園芸用殺菌剤の提供

Offer of novel horticultural microbicide

【解決手段】

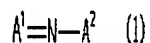
[Means to Solve the Problems]

式(1)

Formula (1)

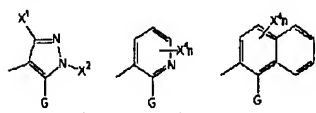
【化 1】

[Chemical Formula 1]

〔式中、A<sup>1</sup>は置換されていてもよいヘテロ環を表し、A<sup>2</sup>は〕{In Formula, A<sup>1</sup> to display optionally substitutable heterocyclic ring, as for A<sup>2</sup>}

【化 2】

[Chemical Formula 2]





等から選ばれる基を表し、G は  $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$  等を表し、 $\text{X}^1$  および  $\text{X}^2$  はそれぞれ独立にハロゲン、アルキル等を表し、 $\text{X}^4$  はハロゲン、アルキル等から選ばれる同一又は相異なっているもよい置換基を表し、n は置換基の数を表し、0~6 である。

]で表されるヘテロ環イミノ芳香族化合物または農薬として許容されるその塩、およびそれらから選ばれる 1 種以上を有効成分として含有する農薬用殺菌剤。

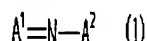
### Claims

#### 【特許請求の範囲】

#### 【請求項 1】

式(1)

#### 【化 1】



〔式中、 $\text{A}^1$  は、〕

#### 【化 2】



を表し、 $\text{Va}$ 、 $\text{Vb}$ 、 $\text{Vc}$  および  $\text{Vd}$  はそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子を表し、 $\text{Ve}$  は炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合を表し、但し、 $\text{Va}$ 、 $\text{Vb}$ 、 $\text{Vc}$ 、 $\text{Vd}$  および  $\text{Ve}$  の少なくともいずれか一つは窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、 $\text{Va-Vb}$ 、 $\text{Vb-Vc}$ 、 $\text{Vc-Vd}$ 、 $\text{Vd-Ve}$  の結合は、それぞれ単結合でも 2 重結合でもよく、それぞれの原子上に水素原子または Y が結合していてもよく、

$\text{A}^2$  は、 $\text{A}^2\text{a}$  から  $\text{A}^2\text{y}$

#### 【化 3】

Such as from group which is chosen is displayed, G displays  $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$  etc, displays  $\text{X}^1$  and  $\text{X}^2$  halogen, alkyl etc in respective independence,  $\text{X}^4$  identical or different which is chosen from halogen, alkyl etc displays substituent which is possible to be, the n displays number of substituents, 0 - 6 is.

) With as heterocyclic ring imino aromatic compound or pesticide which is displayed acceptable its salt, and the horticultural microbicide. which contains one kind or more which is chosen from those as the active ingredient

[Claim(s)]

[Claim 1]

Formula (1)

[Chemical Formula 1]

{In Formula, as for  $\text{A}^1$ , }

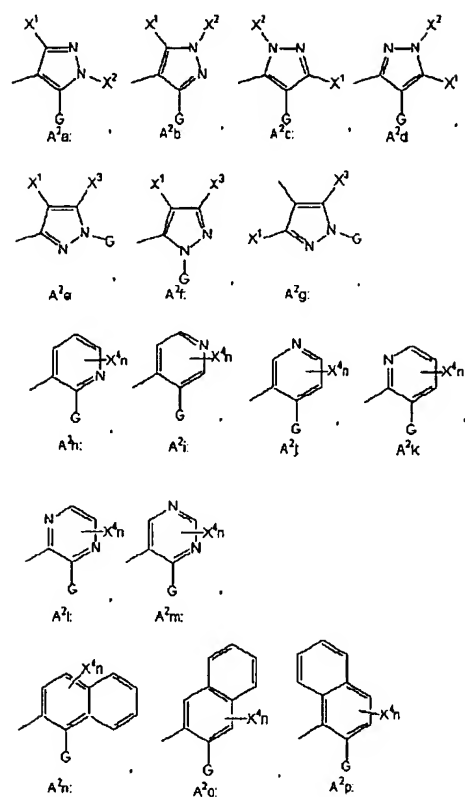
[Chemical Formula 2]

You display,  $\text{Va}$ ,  $\text{Vb}$ ,  $\text{Vc}$  and  $\text{Vd}$  display carbon atom, nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom in the respective independence,  $\text{Ve}$  displays carbon atom, nitrogen atom, oxygen atom, sulfur atom or single bond, however, at least any one of  $\text{Va}$ ,  $\text{Vb}$ ,  $\text{Vc}$ ,  $\text{Vd}$  and  $\text{Ve}$  with nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom, connection of  $\text{Va-Vb}$ ,  $\text{Vb-Vc}$ ,  $\text{Vc-Vd}$ ,  $\text{Vd-Ve}$ , with respective single bond and to be good with double bond, hydrogen atom or Y has been allowed to have connected on respective atom,

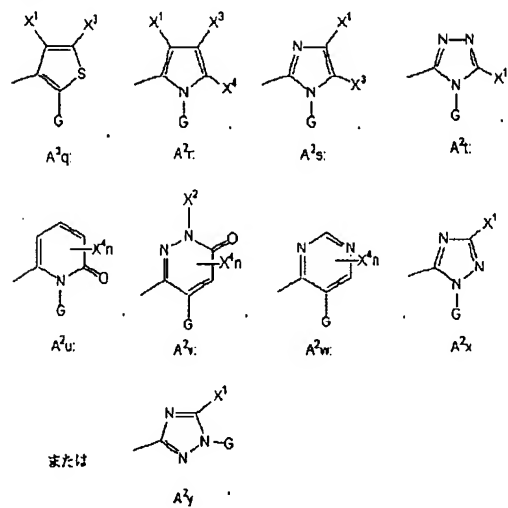
As for  $\text{A}^2$ , from  $\text{A}^2\text{a}$

$\text{A}^2\text{y}$

[Chemical Formula 3]



## 【化 4】



から選ばれる基を表し、

G は、G<sup>1</sup> から G<sup>14</sup>

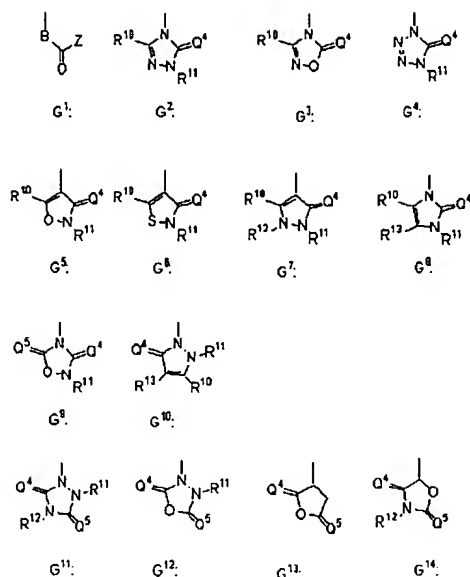
## 【化 5】

## [Chemical Formula 4]

Empty group which is chosen displaying,

As for G, from G<sup>1</sup> to G<sup>14</sup>

## [Chemical Formula 5]



から選ばれる基を表し、

Z は、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$  または  $-NR^2R^3$  であり、

B は、 $-CH_2-$ 、 $-C(=CH-OR^4)$  または  $-C(=N-OR^4)-$  であり、

Y は、 $Y'-D-(CH_2)_p$  であるか(但し、Y が 2 個以上の時は、同一または異なってもよい。)、 $A^1$  の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々 1~3 個含んでいてもよい 3~7 員環または  $C=Q^1$  を形成するか、あるいは Va と Vb、Vb と Vc、Vc と Vd または Vd と Ve 上の 2 個の置換基 Y とうしが一緒になって、Va と Vb、Vb と Vc、Vc と Vd または Vd と Ve とともに炭素原子、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった 1 種以上の原子を含み、Y で置換されていてもよく、ベンゼン環が一つ縮環していてもよい 5 または 6 員環を形成しており、D は、単結合、 $-NR^5-$ 、 $-C(=Q^2)-$ 、 $-NR^5-C(=Q^2)-$ 、 $-C(=Q^2)-C(=Q^3)-$ 、 $-CR^6=N-$ 、 $-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-N=CR^6-$ 、 $-N=CR^6-O-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-O-CR^6=N-O-$ 、 $-O-N=CR^6-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-NR^5-$  または  $-O-N=CR^6-CR^6=N-NR^5-$  であり、

Empty group which is chosen displaying,

As for Z, with  $-OR^{sup1}$ ,  $-SR^{sup1}$  or  $-NR^{sup2}R^{sup3}$ ,

As for B,  $-CH_{sub2}$ ,  $-C(=CH-OR^{sup4})$  or  $-C(=N-OR^{sup4})$  - with,

Y is  $Y^*-D-(CH_{sub2})_p$  or, with said carbon atom oxygen atom, nitrogen atom or the sulfur atom each 1 - 3 3 - 7 -member ring where it is possible to include or is  $C=Q^{sup1}$  formed (However, when Y is 2 or more, also identical or different is good. ), with Y of 2 it substitutes on same carbon atom of  $A^{sup1}$ ?, Or Va and Vb, Vb and Vc, Vc and Vd or Vd and Ve substituent Y of 2 on becoming simultaneous, with Va and Vb, Vb and Vc, Vc and Vd or Vd and Ve same it is chosen from carbon atom, nitrogen atom, oxygen atom and sulfur atom or including atom of the one kind or more which becomes difference, optionally substitutable, benzene ring to form 5 or 6 members rings which one condensed ring it is possible to have done with Y, as for D, single bond,  $-NR^{sup5}$ ,  $-C(=Q^{sup2})$ ,  $-NR^{sup5}-C(=Q^{sup2})$ ,  $-C(=Q^{sup2})-C(=Q^{sup3})$ ,  $-CR^6=N$ ,  $-N=CR^6$ ,  $-CR^6=N-N=CR^6$ ,  $-N=CR^6-O-N=CR^6$ ,  $-CR^6=N-O$ ,  $-CR^6=N-O-CR^6=N-O$ ,  $-O-N=CR^6-CR^6=N-O$ ,  $-CR^6=N-NR^5$  or  $-O-N=CR^6-CR^6=N-NR^5$  -

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup> および Q<sup>3</sup> は、各々独立に、=O、=S、=N-R<sup>7</sup>または=C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)であり、

Q<sup>4</sup>および Q<sup>5</sup> は、各々独立に=O または=S であり、

X<sup>1</sup> および X<sup>3</sup> は、各々独立にハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub> アミノ、NO<sub>2</sub>、CN、ホルミル、OH、SH、NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシであり、

X<sup>2</sup> は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルまたは R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルであり、

X<sup>4</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub> アミノ、NO<sub>2</sub>、CN、ホルミル、OH、SH、NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシであり(但し、置換する X<sup>4</sup> が、2 個以上の場合には同一か相互に異なってもよい。)、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> は、各々独立に、水素原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シ

NR<sup><sup>5</sup></sup>

As for Q<sup><sup>1</sup></sup>

As for Q<sup><sup>4</sup></sup>

As for X<sup><sup>1</sup></sup>

C<sub><sub>1</sub></sub>

As for X<sup><sup>2</sup></sup>

As for X<sup><sup>4</sup></sup>

As for R<sup><sup>1</sup></sup>

クロアルキル、 $C_1\sim C_6$  アルコキシ  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルまたは  $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキルであり、

$R^3$  は、水素原子、 $C_1\sim C_6$  アルキル、 $C_1\sim C_6$  ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$  アルコキシ  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルまたは  $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキルであり、

$R^5$  および  $R^6$  は、

各々独立に、

ハロゲン、

$C_1\sim C_6$  アルキル、

$C_1\sim C_6$  ハロアルキル、

$C_3\sim C_6$  シクロアルキル、

$C_1\sim C_6$  アルコキシ、

$C_1\sim C_6$  アルコキシ  $C_1\sim C_6$  アルキル、

$C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキル、

$C_1\sim C_6$  ハロアルコキシ、

$C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル、

$C_1\sim C_6$  アルキルスルフィニル、

$C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル、

$C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルフェニル、

$C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルフィニル、

$C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、

$C_2\sim C_6$  アルケニル、

$C_{1\sim 6}$  alkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  haloalkyl ,  
 $C_{3\sim 6}$  cycloalkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  alkoxy  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl sulfonyl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,  $R^{sup>a}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl or  $R^{sup>a}$  with optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,

As for  $R^{sup>3}$ , with hydrogen atom ,  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  haloalkyl ,  
 $C_{3\sim 6}$  cycloalkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  alkoxy  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl sulfonyl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,  $R^{sup>a}$  with optionally substitutable phenyl ,  $R^{sup>a}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl or  $R^{sup>a}$  with optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{1\sim 6}$  alkyl ,

As for  $R^{sup>5}$  and  $R^{sup>6}$ ,

In each independence,

halogen ,

$C_{1\sim 6}$  alkyl ,

$C_{1\sim 6}$  haloalkyl ,

$C_{3\sim 6}$  cycloalkyl ,

$C_{1\sim 6}$  alkoxy ,

$C_{1\sim 6}$  alkoxy

$C_{1\sim 6}$  alkyl ,

$C_{1\sim 6}$  alkyl sulfonyl

$C_{1\sim 6}$  alkyl ,

$C_{1\sim 6}$  haloalkoxy ,

$C_{1\sim 6}$  alkyl sulfonyl ,

$C_{1\sim 6}$  alkyl sulfinyl ,

$C_{1\sim 6}$  alkyl sulfonyl ,

$C_{1\sim 6}$  haloalkyl sulfonyl ,

$C_{1\sim 6}$  haloalkyl sulfinyl ,

$C_{1\sim 6}$  haloalkyl sulfonyl ,

$C_{2\sim 6}$  alkenyl ,

$C_2\sim C_6$  ハロアルケニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルオキシ、

$C_2\sim C_6$  ハロアルキニルオキシ、 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフェニル、 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフィニル、 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルホニル、 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフェニル、 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフィニル、 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルホニル、 $NO_2$ 、 $CN$ 、ホルミル、 $OH$ 、 $SH$ 、 $SCN$ 、 $C_1\sim C_6$  アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシ、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは  $-NU^1U^2$  であり、

但し、 $R^6$  は水素原子であってもよく、

$R^7$  は、  
 水素原子、

$C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl oxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyloxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl oxy ,

With  $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyloxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfonyl ,  
 $NO_{<sub>2</sub>}$ ,  $CN$ , formyl ,  $OH$ ,  $SH$ ,  $SCN$ ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkoxy carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl oxy ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl ,  $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl sulfonyl ,  $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfonyl ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl ,  $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,  $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl carbonyl ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $R^{<sup>a</sup>}$  optionally substitutable heteroaryl carbonyl  
 or with  $-NU^{<sup>1</sup>}U^{<sup>2</sup>}$  ,

However,  $R^{<sup>6</sup>}$  to be good even with hydrogen atom ,

As for  $R^{<sup>7</sup>}$  ,  
 hydrogen atom ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルスルホニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシカルボニルまたは R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルであり、

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、各々独立に、水素原子、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル、NO<sub>2</sub>、CN、ホルミルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニルであり、R<sup>10</sup> は、水素原子、ハロゲン、R<sup>14</sup>、-OR<sup>14</sup>、-SR<sup>14</sup>、-SOR<sup>14</sup>、または-SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup> であり、

R<sup>11</sup> は、水素原子、R<sup>14</sup> または CN であり、

R<sup>12</sup> は、水素原子または R<sup>14</sup> であり、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl ,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

With C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl carbonyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenoxy ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy , R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl sulfonyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfonyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl carbonyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenoxy

carbonyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl carbonyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl or R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

As for R<sup>8</sup> and R<sup>9</sup>, in each independence, with hydrogen atom , halogen ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl , NO<sub>2</sub> ,

CN, formyl or C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

carbonyl , asfor R<sup>10</sup>, hydrogen atom , halogen ,

R<sup>14</sup>, -OR<sup>14</sup>, -SR<sup>14</sup>, -SOR<sup>14</sup>, or with

-SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, or with

-SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, or with

As for R<sup>11</sup>, with hydrogen atom ,

R<sup>14</sup> or CN,

As for R<sup>12</sup>, with hydrogen atom or

R<sup>14</sup>

R<sup>13</sup> は、水素原子、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルであり、

R<sup>14</sup> は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニルであり、

Y' は、

ハロゲン、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> アルキル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub> アルケニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub> アルキニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> アルコキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルオキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニスルフェニル、

R<sup><sup>14</sup></sup>

As for R<sup><sup>13</sup></sup>

, with hydrogen atom , halogen ,  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl ,  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>haloalkyl ,  
C<sub><sub>3</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>cycloalkyl ,  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkoxy  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl ,  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkenyl or  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkynyl ,

As for R<sup><sup>14</sup></sup>

, with

C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl ,  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>haloalkyl ,  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkenyl ,  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>haloalkenyl ,  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkynyl ,  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>haloalkynyl ,  
C<sub><sub>3</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>cycloalkyl ,  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl carbonyl or  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkoxy carbonyl ,

As for Y\*

,

halogen ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>12</sub></sub>alkyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>3</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>cycloalkyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>12</sub></sub>alkenyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>12</sub></sub>alkynyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>12</sub></sub>alkoxy ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkoxy  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkoxy ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkenyl oxy ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkynyl oxy ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl sulfenyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkenyl sulfenyl ,

With R<sup><sup>b</sup></sup> optionally substitutable  
C<sub><sub>2</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkynyl sulfenyl ,



R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシ、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルスルホニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアルスルフィニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアルスルフェニル、

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenoxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfinyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulphenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl ,

With R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfinyl ,

ル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、NO<sub>2</sub>、CN、ホルミルまたはナフチルであり、

R<sup>a</sup>は、

ハロゲン、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル、

R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfinyl, R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfonyl, R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenyl

carbonyl, R<sup>c</sup> with optionally substitutable

phenyl carbonyl oxy, R<sup>c</sup> with optionally

substitutable phenoxy carbonyl, R<sup>c</sup> with

optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl

carbonyl, R<sup>c</sup> with optionally substitutable

heteroaryl carbonyl oxy, R<sup>c</sup> with optionally

substitutable heteroaryloxy carbonyl, R<sup>c</sup> with

optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl,

R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy,

NO<sub>2</sub>, CN, formyl or naphthyl,

As for R<sup>a</sup>,

halogen,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfinyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfinyl,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl,

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルホニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルフェニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルフィニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルホニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルホニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルフェニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルフィニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルホニル、NO<sub>2</sub>、CN、ホルミル、SH、OH、SCN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、フェニルまたは-NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>であって、置換するR<sup>a</sup>の数は1ないし5個であり(但し、R<sup>a</sup>が2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい)、

R<sup>b</sup>は、

ハロゲン、

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> ハロアルケニルオキシ、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl oxy ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl oxy ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfinyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl oxy ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl oxy ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl sulfinyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfinyl ,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfonyl ,  
NO<sub>2</sub>, CN, formyl , SH, OH, SCN,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl carbonyl ,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy , phenyl  
or as for quantity of R<sup>a</sup> which with  
-NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>, is substituted 1 to 5 with  
(However, when R<sup>a</sup> is 2 or more , it is possible  
to differ similarly or mutually),

As for R<sup>b</sup>,

halogen ,

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkoxy ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl sulfenyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl sulfinyl ,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl ,

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl oxy ,

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalkenyl oxy ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl sulfanyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkenyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkenyl sulfanyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkenyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl oxy ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkynyloxy ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl sulfanyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl sulfonyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkinyl sulfenyl ,  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkinyl sulfanyl ,  
1 to 4 which with  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>haloalkinyl sulfonyl ,  
NO<sub>2</sub>, CN, formyl, OH, SH, SCN,  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl ,  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl carbonyl ,  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenoxy ,  
R<sup>a</sup> with the optionally substitutable phenyl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy , R<sup>a</sup>  
with optionally substitutable phenyl sulfonyl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl  
sulfonyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable  
phenyl carbonyl , R<sup>a</sup> with optionally  
substitutable phenoxy carbonyl , R<sup>a</sup> with  
optionally substitutable phenyl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl  
carbonyl , R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl or  
-NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup> is with optionally  
substitutable heteroaryloxy carbonyl , or or R<sup>a</sup> ,  
is chosen from oxygen atom , nitrogen atom or sulfur atom  
from 3 may include heteroatom with 7 -member ring , As for  
quantity of R<sup>b</sup> which it substitutes with 1 - 8  
(However, when R<sup>b</sup> is 2 or more , it is possible  
to differ similarly or mutually),

R <sup>c</sup> は、	As for R <sup>c</sup> ,
ハロゲン、	halogen ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> アルキル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> alkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> cycloalkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> アルケニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> alkenyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> アルキニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> alkynyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> アルコキシ、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> alkoxy ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルオキシ、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl oxy ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルオキシ、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl oxy ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulphenyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl sulphenyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl sulphenyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl sulfinyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl sulfinyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルホニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルホニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl sulfonyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシカルボニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカル	With R <sup>b</sup> optionally substitutable

ボニルオキシ、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,
NO <sub>2</sub> 、	NO <sub>2</sub> ,
CN、	CN,
ホルミル、	formyl ,
OH、	OH,
SH、	SH,
SCN、	SCN,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl carbonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfinyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryloxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、R <sup>a</sup> で置換されていてもよ	With R <sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy , R <sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfinyl , R <sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfenyl , R <sup>a</sup> with the optionally substitutable heteroaryl sulfonyl , R <sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

いヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキルスルフィニル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシ、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、 $R^a$  で置換されていてもよいヘテロアリール  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシまたは  $-NU^1U^2$  であり、置換する  $R^c$  の数は 1 ないし 5 個であり(但し、 $R^c$  が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい)、

$U^1$  および  $U^2$  は、各々独立に、水素原子、 $C_1\sim C_6$  アルキル、 $C_1\sim C_6$  ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$  アルコキシ  $C_1\sim C_6$  アルキル、 $C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル  $C_1\sim C_6$  アルキル、ホルミル、 $C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$  アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルまたは  $C_1\sim C_6$  ハロアルキルカルボニルであるか、あるいは  $U^1$  および  $U^2$  が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であり、

$n$  は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

$p$  は、繰り返しの数を表し、0 から 2 である。

]で表されるヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

【請求項 2】

$A^1$  が

【化 6】

$C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfinyl ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfinyl ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfonyl ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
carbonyl ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable  
phenyl carbonyl oxy ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally  
substitutable phenoxy carbonyl ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with  
optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl oxy ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable heteroaryl  
carbonyl ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable  
heteroaryl carbonyl oxy ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with optionally  
substitutable heteroaryloxy carbonyl ,  $R_{<sup>a</sup>}$  with  
optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $R_{<sup>a</sup>}$  optionally substitutable heteroaryl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl oxy or as for  
the quantity of  $R_{<sup>c</sup>}$  which with  
 $-NU_{<sup>1</sup>}U_{<sup>2</sup>}$  , is substituted 1 to 5 with  
(However, when  $R_{<sup>c</sup>}$  is 2 or more , it is possible  
to differ similarly or mutually),

$U_{<sup>1</sup>}$  and  $U_{<sup>2</sup>}$  , in each independence,  
are hydrogen atom ,  $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl ,  
 $C_{<sub>3</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  cycloalkyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfinyl  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl , formyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl or the  
 $C_{<sub>1</sub>\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl carbonyl , or 1 to  
4 where or  $U_{<sup>1</sup>}$  and  $U_{<sup>2</sup>}$  become  
simultaneous and are chosen from oxygen atom , nitrogen  
atom or sulfur atom from 3 may include the heteroatom with  
7 -member ring ,

$n$  to display number of substituents , with 0 to 4 ,

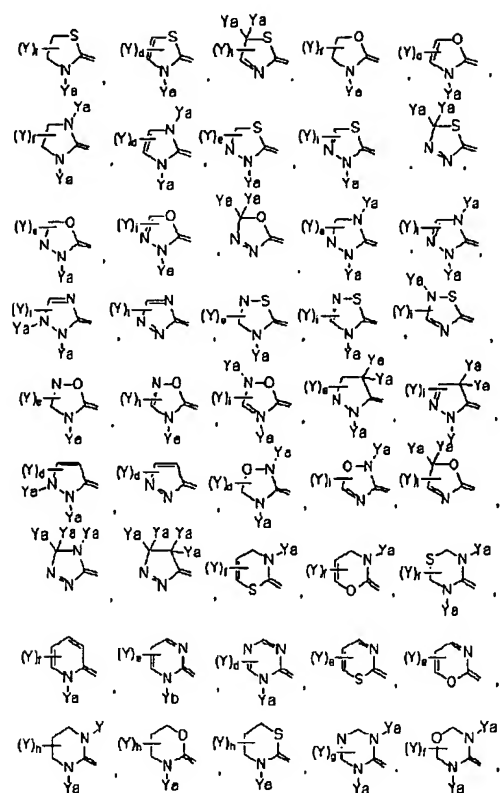
$p$  displays quantity of repeated , they are 0 to 2 .

) With heterocyclic ring imino aromatic compound which is  
displayed or as pesticide acceptable salt .

[Claim 2]

$A_{<sup>1</sup>}$

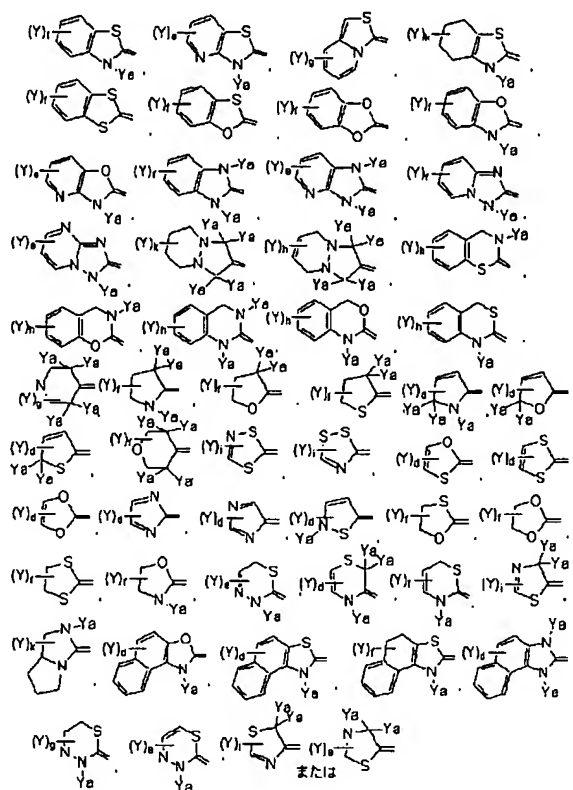
[Chemical Formula 6]



【化 7】

[Chemical Formula 7]





であり、d は、置換基の数を表し、0 から 2 であり、e は、置換基の数を表し、0 から 3 であり、f は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、g は、置換基の数を表し、0 から 5 であり、h は、置換基の数を表し、0 から 6 であり、i は、置換基の数を表し、0 から 1 であり、j は、置換基の数を表し、0 から 7 であり、k は、置換基の数を表し、0 から 8 であり、Ya および Y は、互いに独立に Y'-D-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-であるか(但し、Ya と Y との合計が 2 個以上の時は、Ya どうし、Y どうしまたは Ya と Y とは互いに同一または異なってもよい。)、A<sup>1</sup> の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y または Ya により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々 1~3 個含んでいてもよい 3~7 員環または C=Q<sup>1</sup> を形成し、Ya は水素原子を表していてもよい、請求項 1 記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

### 【請求項 3】

A<sup>1</sup> が 5 員環ヘテロ環を表す請求項 1 または 2 に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

### 【請求項 4】

So, d to display number of substituents, with 0 to 2, e to display number of substituents, with 0 to 3, f to display number of substituents, with 0 to 4, g to display number of substituents, with 0 to 5, h to display the number of substituents, with 0 to 6, i to display number of substituents, with 0 to 1, the j to display number of substituents, with 0 - 7, k displays number of substituents, from 0 with 8, Ya and Y are Y\*-D- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>- mutually in independence or, with said carbon atom oxygen atom, nitrogen atom or sulfur atom each 1 - 3 3 - 7 -member ring where it is possible to include or C=Q<sup>1</sup> is formed (However, when total of Ya and Y is 2 or more, the Ya and Y or Ya and Y also identical or different is good mutually. ), with Y or Ya of 2 its substituents on same carbon atom of A<sup>1</sup>, heterocyclic ring imino aromatic compound Ya has been allowed to have displayed hydrogen atom, in Claim 1 states or as pesticide acceptable salt.

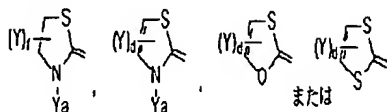
### 【Claim 3】

A<sup>1</sup> is displayed heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in Claim 1 or 2 which or 5 -member ring heterocyclic ring as pesticide acceptable salt.

### 【Claim 4】

A<sup>1</sup>が

【化 8】



(式中、Y、Ya、dおよびfは請求項2と同様の意味を表す。)を表す請求項1または2に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

【請求項5】

Ya および Y は、互いに独立に Y'-D-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-であるか(但し、Ya と Y との合計が 2 個以上の時は、Ya どうし、Y どうしまたは Ya と Y とは互いに同一または異なってもよい。)、A<sup>1</sup> の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y または Ya により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1~3 個含んでもよい 3~7 員環または C=Q<sup>1</sup>を形成する、請求項 2、3 または 4 に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

【請求項6】

G が G<sup>1</sup>を表す請求項 1、2、3、4 または 5 に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

【請求項7】

農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシュウ酸塩である請求項 1、2、3、4、5 または 6 に記載の塩。

【請求項8】

請求項 1、2、3、4、5、6 または 7 に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

【請求項9】

請求項 1、2、3、4、5、6 または 7 に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

## Specification

【発明の詳細な説明】

【0001】

A<sup>1</sup>

[Chemical Formula 8]

heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in Claim 1 or 2 which displays (In Formula, Y, Ya, d and f display meaning of being similar to Claim 2 . ) or as the pesticide acceptable salt .

[Claim 5]

Ya and Y are Y'-D- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-mutually independence or, with said carbon atom oxygen atom , nitrogen atom or sulfur atom each 1 - 3 3 -7 -member ring where it is possible to include or C=Q<sup>1</sup> is formed (However, when total of Ya and Y is 2 or more , the Ya and Y or Ya and Y also identical or different is good mutually. ), with Y or Ya of 2 it substitutes on same carbon atom of the A<sup>1</sup>, heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in Claim 2 , 3 or 4 or as pesticide acceptable salt .

[Claim 6]

heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in Claim 1 , 2, 3 , 4 or 5 where G displays the G<sup>1</sup> or as pesticide acceptable salt .

[Claim 7]

salt . which is stated in Claim 1 , 2, 3 , 4, 5 or 6 where acceptable salt is acetate , hydrobromide , hydroiodide , formate salt , acetate or oxalate as pesticide

[Claim 8]

Claim 1 , 2, 3 , 4, 5, 6 or pesticide . which contains one kind or more which is chosen from heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt which is stated in 7 as active ingredient

[Claim 9]

Claim 1 , 2, 3 , 4, 5, 6 or microbicide . which contains one kind or more which is chosen from heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt which is stated in 7 as active ingredient

[Description of the Invention]

【0001】

## 【発明の属する技術分野】

本発明は、新規なヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩、ならびに該ヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤に関する。

【0002】

## 【従来の技術】

ある種のイミノ化合物は、国際特許出願公開公報(WO-95/27693 号公報)、ヨーロッパ特許出願公報(EP-254426 号公報)で知られていて、農園芸用殺菌剤としての用途が開示されている。

【0003】

しかし、本発明化合物のヘテロ環イミノ芳香族化合物は、文献未記載の新規化合物である。

【0004】

## 【発明が解決しようとする課題】

既存の農園芸用殺菌剤は、耐性菌の増加や既存剤のスペクトラムの狭さ等からその効力や残効性の面で満足するべきものではない。

そのため、低薬量で高い効力を有するとともに、より対象作物に対し安全性の高い殺菌剤の開発が要望されている。

【0005】

## 【発明を解決するための手段】

本発明者らは、このような状況に鑑み、優れた農園芸用殺菌剤を見いだすべく種々検討した結果、新規なヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩が殺菌剤として顕著な活性を有し、対象作物に対しても安全であることを見出し、本発明に至った。

【0006】

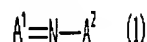
すなわち、本発明は、下記の〔1〕ないし〔9〕に関するものである。

【0007】

〔1〕 式(1)

【0008】

【化 9】



## [Technological Field of Invention]

this invention regards microbicide which contains one kind or more which is chosen from novel heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt, and said heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt as active ingredient.

【0002】

## [Prior Art]

As for imino compound of a certain kind, PCT Patent Publication disclosure (WO -95/27693 disclosure), being known with the European Patent Application disclosure (EP -254426 disclosure), application as horticultural microbicide is disclosed.

【0003】

But, heterocyclic ring imino aromatic compound of the compound of this invention is novel compound of unrecorded in the literature.

【0004】

## [Problems to be Solved by the Invention]

existing horticultural microbicide is not effectiveness and something which it should be satisfied in aspect of residual effectiveness from increase of resistant fungi and narrowness etc of spectrum of existing agent.

Because of that, it possesses high effectiveness with low dose as, from, development of microbicide where safety is high vis-a-vis target crop is demanded.

【0005】

## [Means to Solve the Problems]

In order that you consider these inventors, to condition a this way, you discover horticultural microbicide which is superior, various result and novel heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt which were examined it possessed marked activity as microbicide, it discovered fact that it is safe vis-a-vis target crop reached to this invention.

【0006】

namely, this invention description below [1] or is something regarding [9].

【0007】

[1] Formula (1)

【0008】

[Chemical Formula 9]

[0009]

〔式中、A<sup>1</sup>は、〕

[0010]

【化 10】

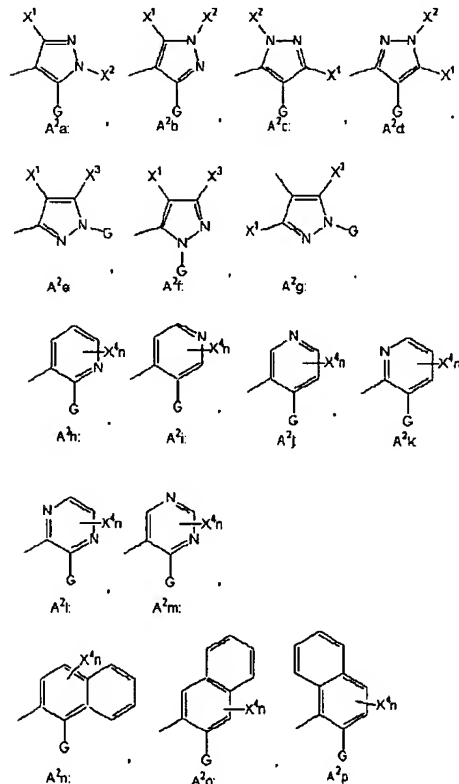


[0011]

を表し、Va、Vb、Vc および Vd はそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子を表し、Ve は炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合を表し、但し、Va、Vb、Vc、Vd および Ve の少なくともいずれか一つは窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、Va-Vb、Vb-Vc、Vc-Vd、Vd-Veの結合は、それぞれ単結合でも 2 重結合でもよく、それぞれの原子上に水素原子または Y が結合していてもよく、A<sup>2</sup>は、A<sup>2a</sup> から A<sup>2w</sup>

[0012]

【化 11】



[0009]

{In Formula, as for A<sup>1</sup>, }

[0010]

[Chemical Formula 10]

[0011]

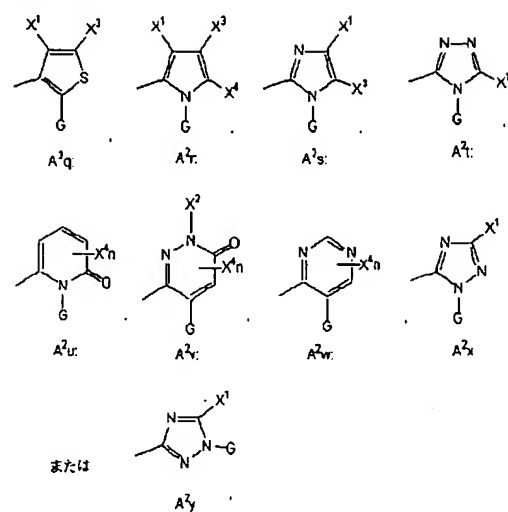
You display, Va, Vb, Vc and Vd display carbon atom, nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom in the respective independence, Ve displays carbon atom, nitrogen atom, oxygen atom, sulfur atom or single bond, however, at least any one of Va, Vb, Vc, Vd and Ve with nitrogen atom, oxygen atom or sulfur atom, connection of Va-Vb, Vb-Vc, Vc-Vd, Vd -Ve, with respective single bond and to be good with double bond, hydrogen atom or Y has been allowed to have connected on respective atom, As for A<sup>2</sup>, from A<sup>2a</sup> to A<sup>2w</sup>

[0012]

[Chemical Formula 11]

【0013】

【化 12】

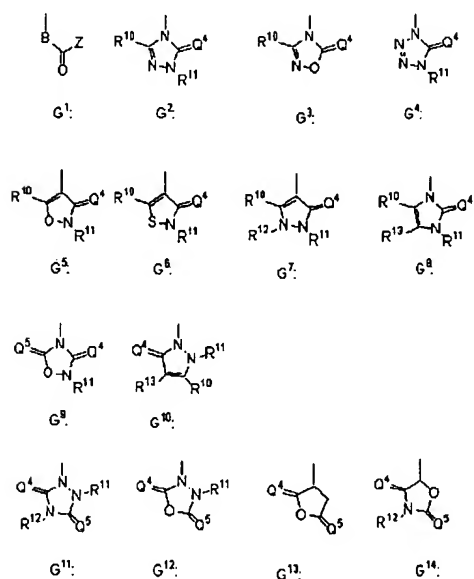


【0014】

から選ばれる基を表し、 $G$  は、 $G^1$  から  $G^{14}$ 

【0015】

【化 13】



【0016】

から選ばれる基を表し、

 $Z$  は、

【0013】

[Chemical Formula 12]

【0014】

Empty to display group which is chosen, as for  $G$ , from  $G^{1}$  to  $G^{14}$ 

【0015】

[Chemical Formula 13]

【0016】

Empty group which is chosen displaying,

As for  $Z$ ,

-OR<sup>1</sup>、  
 -SR<sup>1</sup>または-NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>であり、  
 Bは、  
 -CH<sub>2</sub>-、  
 -C(=CH-OR<sup>4</sup>)-または-C(=N-OR<sup>4</sup>)-であり、  
 Yは、  
 Y'-D-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-であるか(但し、Yが2個以上の時は、同一または異なってもよい。)、  
 A<sup>1</sup>の同一炭素原子上に置換した2個のYにより、  
 該炭素原子とともに酸素原子、  
 窒素原子または硫黄原子を各々1~3個含んでいてもよい3~7員環またはC=Q<sup>1</sup>を形成するか、  
 あるいはVaとVb、  
 VbとVc、  
 VcとVdまたはVdとVe上の2個の置換基Yどうしが一緒になって、  
 VaとVb、  
 VbとVc、  
 VcとVdまたはVdとVeとともに炭素原子、  
 窒素原子、  
 酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった1種以上の原子を含み、  
 Yで置換されていてもよく、  
 ベンゼン環が一つ縮環していてもよい5または6員環を形成しており、  
 Dは、  
 単結合、  
 -NR<sup>5</sup>-、  
 -C(=Q<sup>2</sup>)-、  
 -NR<sup>5</sup>-C(=Q<sup>2</sup>)-、  
 -C(=Q<sup>2</sup>)-C(=Q<sup>3</sup>)-、  
 -CR<sup>6</sup>=N-、  
 -N=CR<sup>6</sup>-、

-OR<sup><sup>1</sup></sup>

,  
 With -SR<sup><sup>1</sup></sup> or  
 -NR<sup><sup>2</sup></sup>R<sup><sup>3</sup></sup>,  
 As for B,  
 -CH<sup><sub>2</sub></sup>-,  
 -C (=CH-OR<sup><sup>4</sup></sup>) - or -C (=N- OR<sup><sup>4</sup></sup>)  
 - with,  
 As for Y,  
 It is a Y\*-D- (CH<sup><sub>2</sub></sup>) <sup><sub>p</sub></sup>- or,  
 (However, when Y is 2 or more , also identical or different is good. ),  
 In Y of 2 it substitutes on same carbon atom of  
 A<sup><sup>1</sup></sup> depending,  
 With said carbon atom oxygen atom ,  
 nitrogen atom or sulfur atom each 1 - 3 3 - 7 -member ring  
 where it is possible to include or is C=Q<sup><sup>1</sup></sup>  
 formed?,  
 Or Va and Vb,  
 Vb and Vc,  
 Vc and Vd or Vd and Ve substituent Y of 2 on becoming  
 simultaneous,  
 Va and Vb,  
 Vb and Vc,  
 With Vc and Vd or Vd and Ve carbon atom ,  
 nitrogen atom ,  
 Same it is chosen from oxygen atom and sulfur atom or  
 including atom of the one kind or more which becomes  
 difference,  
 With Y optionally substitutable ,  
 benzene ring forms 5 or 6 members rings which one  
 condensed ring it is possible to have done,  
 As for D,  
 single bond ,  
 -NR<sup><sup>5</sup></sup>-,  
 -C (=Q<sup><sup>2</sup></sup>) -,  
 -NR<sup><sup>5</sup></sup>-C (=Q<sup><sup>2</sup></sup>) -,  
 -C (=Q<sup><sup>2</sup></sup>) -C (=Q<sup><sup>3</sup></sup>) -,  
 -CR<sup><sup>6</sup></sup>=N- ,  
 -N=CR<sup><sup>6</sup></sup>-,

-CR<sup>6</sup>=N-N=CR<sup>6</sup>-,  
 -N=CR<sup>6</sup>-O-N=CR<sup>6</sup>-,  
 -CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 -CR<sup>6</sup>=N-O-CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 -O-N=CR<sup>6</sup>-CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 -CR<sup>6</sup>=N-NR<sup>5</sup>-または-O-N=CR<sup>6</sup>-CR<sup>6</sup>=N-NR<sup>5</sup>-で  
 あり、

Q<sup>1</sup>,  
 Q<sup>2</sup>および Q<sup>3</sup> は、  
 各々独立に、  
 =O、  
 =S、  
 =N-R<sup>7</sup>または=C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)であり、

Q<sup>4</sup>および Q<sup>5</sup> は、  
 各々独立に=Oまたは=Sであり、  
 X<sup>1</sup>および X<sup>3</sup> は、  
 各々独立にハロゲン、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオ、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、  
 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>アミノ、

NO<sub>2</sub>,  
 CN,  
 ホルミル、  
 OH,  
 SH,  
 NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルカルボニル、

-CR<sup>6</sup>=N-N=CR<sup>6</sup>-,  
 -N=CR<sup>6</sup>-O-N=CR<sup>6</sup>-,  
 -CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 -CR<sup>6</sup>=N-O-CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 -O-N=CR<sup>6</sup>-CR<sup>6</sup>=N-O-,  
 With -CR<sup>6</sup>=N-NR<sup>5</sup>- or  
 -O-N=CR<sup>6</sup>-CR<sup>6</sup>=N-NR<sup>5</sup>-

Q<sup>1</sup>,  
 As for Q<sup>2</sup> and Q<sup>3</sup>,  
 In each independence,  
 =O,  
 =S,  
 =N- R<sup>7</sup> or =C with (R<sup>8</sup> )  
 (R<sup>9</sup> ),

As for Q<sup>4</sup> and Q<sup>5</sup>,  
 In each independence with =O or =S,  
 As for X<sup>1</sup> and X<sup>3</sup>,  
 In each independence halogen ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkoxy ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl thio ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl amino ,  
 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl )  
 amino ,

NO<sub>2</sub>,  
 CN,  
 formyl ,  
 OH,  
 SH,  
 NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,  
 C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl carbonyl ,

$R^a$  で置換されていてもよいフェニル、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシ、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニル  
 または  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシであり、  
 $X^2$  は、  
 $C_1\sim C_6$  アルキル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルまたは  $R^a$  で置換されていてもよいフェニルであり、  
 $X^4$  は、  
 ハロゲン、  
 $C_1\sim C_6$  アルキル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキル、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルチオ、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルアミノ、  
 $(C_1\sim C_6 \text{ アルキル})_2$  アミノ、  
 $NO_2$ 、  
 $CN$ 、  
 ホルミル、  
 $OH$ 、  
 $SH$ 、  
 $NU^1U^2$ 、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルカルボニル、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシ、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニル  
 または  $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシであり  
 (但し、置換する  $X^4$  が、2 個以上の場合は同一  
 が相互に異なってもよい。)、  
 $R^1$ 、  
 $R^2$  および  $R^4$  は、  
 各々独立に、

With  $R^{a<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenyl ,  
 With  $R^{a<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenoxy ,  
 With  $R^{a<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 carbonyl or  $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl carbonyl  
 oxy ,  
 As for  $X^{2<sup>2</sup>}$  ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl ,  
 With  $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  haloalkyl or  
 $R^{a<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl ,  
 As for  $X^{4<sup>4</sup>}$  ,  
 halogen ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  haloalkyl ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkoxy ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  haloalkoxy ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl thio ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl amino ,  
 $(C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl )  
 $<sub>2</sub>$  amino ,  
 $NO_{2<sub>2</sub>}$  ,  
 $CN$  ,  
 formyl ,  
 $OH$  ,  
 $SH$  ,  
 $NU^{1<sup>1</sup>}U^{2<sup>2</sup>}$  ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkoxy carbonyl ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  haloalkyl carbonyl ,  
 With  $R^{a<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenyl ,  
 With  $R^{a<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenoxy ,  
 With  $R^{a<sup>a</sup>}$  with optionally substitutable phenyl  
 carbonyl or  $C_{1</sub>}\sim C_{6</sub>}$  alkyl carbonyl  
 oxy (However, when  $X^{4<sup>4</sup>}$  which is substituted,  
 they are 2 or more , it is possible to differ similarly or  
 mutually. ) ,  
 $R^{1<sup>1</sup>}$  ,  
 As for  $R^{2<sup>2</sup>}$  and  $R^{4<sup>4</sup>}$  ,  
 In each independence,



水素原子、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルまたは R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルであり、

R<sup>3</sup> は、

水素原子、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルまたは R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルであり、

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、

各々独立に、

ハロゲン、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

hydrogen atom ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl ,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulphenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

With R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl or R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

As for R<sup>3</sup> ,

hydrogen atom ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl ,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulphenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl ,

With R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl or R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

As for R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> ,

In each independence,

halogen ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl ,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulphenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulphenyl ,

C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルホニル、	NO <sub>2</sub> 、	CN、	ホルミル、	OH、	SH、	SCN、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルコキシカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルオキシ、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルスルホニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルフェニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルフィニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニルスルホニル、	NO <sub>2</sub> 、	CN、	ホルミル、	OH、	SH、	SCN、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルコキシカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、

C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは -NU <sup>1</sup> U <sup>2</sup> であり、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl carbonyl or with -NU <sup>1</sup> U <sup>2</sup> ,
但し、	However,
R <sup>6</sup> は水素原子であってもよく、	R <sup>6</sup> is good even with hydrogen atom ,
R <sup>7</sup> は、	As for R <sup>7</sup> ,
水素原子、	hydrogen atom ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl ,
C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> cycloalkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulphenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R <sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェニルスルホニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルホニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェニルカルボニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、

R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたは R<sup>a</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルカルボニルであり、

R<sup>8</sup>および R<sup>9</sup>は、

各々独立に、

水素原子、

ハロゲン、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルフェニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、

NO<sub>2</sub>、

CN、

ホルミルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルであり、

R<sup>10</sup>は、

水素原子、

ハロゲン、

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryloxy ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy carbonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl carbonyl ,

With R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl or R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,

As for R<sup>8</sup> and R<sup>9</sup>,

In each independence,

hydrogen atom ,

halogen ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl ,

NO<sub>2</sub> ,

CN,

With formyl or C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl ,

As for R<sup>10</sup>,

hydrogen atom ,

halogen ,

R <sup>14</sup> 、	R <sup>14</sup> ,
-OR <sup>14</sup> 、	-OR <sup>14</sup> ,
-SR <sup>14</sup> 、	-SR <sup>14</sup> ,
-SOR <sup>14</sup> 、	-SOR <sup>14</sup> ,
または-SO <sub>2</sub> R <sup>14</sup> であり、	Or with -SO <sub>2</sub> R <sup>14</sup> ,
R <sup>11</sup> は、	As for R <sup>11</sup> ,
水素原子、	hydrogen atom ,
R <sup>14</sup> またはCNであり、	With R <sup>14</sup> or CN,
R <sup>12</sup> は、	As for R <sup>12</sup> ,
水素原子または R <sup>14</sup> であり、	With hydrogen atom or R <sup>14</sup> ,
R <sup>13</sup> は、	As for R <sup>13</sup> ,
水素原子、	hydrogen atom ,
ハロゲン、	halogen ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl ,
C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> cycloalkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy alkyl ,
C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニルまたは C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニルであり、	With C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl or C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl ,
R <sup>14</sup> は、	As for R <sup>14</sup> ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキル、	C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkyl ,
C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkenyl ,
C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルケニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkenyl ,
C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> アルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> alkynyl ,
C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> ハロアルキニル、	C <sub>2</sub> ~C <sub>6</sub> haloalkynyl ,
C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> cycloalkyl ,
C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニルまたは C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシカルボニルであり、	With C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkyl carbonyl or C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,
Y' は、	As for Y' ,
ハロゲン、	halogen ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> アルキル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> alkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> cycloalkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> アルケニル、	With R <sup>b</sup> optionally substitutable C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> alkenyl ,

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub> アルキニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> アルコキシ、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルオ  
キシ、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルオ  
キシ、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスル  
フェニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルス  
ルフェニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルス  
ルフェニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスル  
フィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルス  
ルフィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルス  
ルフィニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスル  
ホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルス  
ルホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルス  
ルホニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカ  
ルボニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカル  
ボニル、

R<sup>b</sup>で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカル  
ボニルオキシ、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシ、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アル  
キル、

R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコ  
キシ、

C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub> alkenyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub> alkynyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> alkoxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl oxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl oxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenoxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfinyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfenyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryloxy ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfinyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfenyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl oxy ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenoxy carbonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、	With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy ,
R <sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールカル	With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl

ボニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

NO<sub>2</sub>、

CN、

ホルミルまたはナフチルであり、

R<sup>a</sup> は、

ハロゲン、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニルオキシ、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルホニル、

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルフェニル、

carbonyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl carbonyl oxy ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,

NO<sub>2</sub> ,

CN,

With formyl or naphthyl ,

As for R<sup>a</sup> ,

halogen ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl ,

C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfinyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl oxy ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyloxy ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfonyl ,



$C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルホニル、  
 $NO_2$ 、  
 $CN$ 、  
 ホルミル、  
 $SH$ 、  
 $OH$ 、  
 $SCN$ 、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシ、  
 フェニルまたは  $-NU^1U^2$  であって、  
 置換する  $R^a$  の数は 1 ないし 5 個であり(但し、 $R^a$  が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい)、  
 $R^b$  は、  
 ハロゲン、  
 $C_3\sim C_6$  シクロアルキル、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシ  $C_1\sim C_6$  アルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル  $C_1\sim C_6$  アルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルコキシ、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルスルフェニル、

$C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkynyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl oxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkynyloxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkynyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkynyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkynyl sulfonyl ,  
 $NO_{<sub>2</sub>}$  ,  
 $CN$  ,  
 formyl ,  
 $SH$  ,  
 $OH$  ,  
 $SCN$  ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl oxy ,  
 phenyl or with  $-NU^{<sup>1</sup>}U^{<sup>2</sup>}$  ,  
 As for quantity of  $R^{<sup>a</sup>}$  which it substitutes 1 to 5 with (However, when  $R^{<sup>a</sup>}$  is 2 or more , it is possible to differ similarly or mutually) ,  
 As for  $R^{<sup>b</sup>}$  ,  
 halogen ,  
 $C_{<sub>3</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  cycloalkyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfenyl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkoxy ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfenyl ,

$C_1\sim C_6$  アルキルスルフィニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルフェニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルフィニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルケニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルケニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルオキシ、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  アルキニルスルホニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフェニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルフィニル、  
 $C_2\sim C_6$  ハロアルキニルスルホニル、  
 $NO_2$ 、  
 $CN$ 、  
 ホルミル、  
 $OH$ 、  
 $SH$ 、  
 $SCN$ 、  
 $C_1\sim C_6$  アルコキシカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  ハロアルキルカルボニル、  
 $C_1\sim C_6$  アルキルカルボニルオキシ、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシ、  
 $R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1\sim C_6$  アルコキシ、

$C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl oxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyloxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkenyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkenyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl oxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyloxy ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkynyl sulfonyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfenyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfinyl ,  
 $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkinyl sulfonyl ,  
 $NO_{<sub>2</sub>}$  ,  
 $CN$  ,  
 formyl ,  
 $OH$  ,  
 $SH$  ,  
 $SCN$  ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  haloalkyl carbonyl ,  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkyl carbonyl oxy ,  
 With  $R^{<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenyl ,  
 With  $R^{<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenoxy ,  
 With  $R^{<sup>a</sup>}$  optionally substitutable phenyl  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$  alkoxy ,

R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryloxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたは R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルカルボニルまたは -NU <sup>1</sup> U <sup>2</sup> であるか、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl or -NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup> is with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl or R<sup>a</sup>?,
あるいは、	Or,
酸素原子、	oxygen atom ,
窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であって、	1 to 4 which is chosen from nitrogen atom or sulfur atom from 3 may include heteroatom with 7 -member ring ,
置換する R <sup>b</sup> の数は 1 ないし 8 個であり(但し、R <sup>b</sup> が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい)、	As for quantity of R<sup>b</sup> which it substitutes with 1 - 8 (However, when R<sup>b</sup> is 2 or more , it is possible to differ similarly or mutually),
R <sup>c</sup> は、	As for R<sup>c</sup> ,
ハロゲン、	halogen ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> アルキル、	With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>alkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>3</sub> ~C <sub>6</sub> シクロアルキル、	With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>cycloalkyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> アルケニル、	With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>alkenyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>2</sub> ~C <sub>12</sub> アルキニル、	With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>alkynyl ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>12</sub> アルコキシ、	With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>alkoxy ,
R <sup>b</sup> で置換されていてもよい C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ	With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルオキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルホニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルホニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

NO<sub>2</sub>、

CN、

ホルミル、

OH、

SH、

SCN、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニル、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl oxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl oxy ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfenyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfenyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfenyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,

NO<sub>2</sub> ,

CN,

formyl ,

OH,

SH,

SCN,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl carbonyl ,

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy ,

R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfanyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfanyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryloxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルコキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfanyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフェニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルフィニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfanyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C <sub>1</sub> ~C <sub>6</sub> アルキルスルホニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニル、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl ,
R <sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、	With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl carbonyl oxy ,

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルカルボニルオキシ、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシまたは-NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>であり、置換するR<sup>c</sup>の数は1ないし5個であり(但し、R<sup>c</sup>が2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい)、U<sup>1</sup>およびU<sup>2</sup>は、各々独立に、水素原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルフェニルC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、ホルミル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルカルボニルまたはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルカルボニルであるか、あるいはU<sup>1</sup>およびU<sup>2</sup>が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環であり、nは、置換基の数を表し、0から4であり、pは、繰り返し数を表し、0から2である。

]で表されるヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

[0017]

[2] A<sup>1</sup>が

[0018]

[化 14]

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenoxy carbonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl ,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy ,

With R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl carbonyl , R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl carbonyl oxy , R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl , R<sup>a</sup> with the optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl , R<sup>a</sup> optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy or as for quantity of R<sup>c</sup> which with -NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>, is substituted (However, when R<sup>c</sup> is 2 or more , it is possible to differ similarly or mutually), as for U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, in each independence, it is a hydrogen atom , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl , C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>cycloalkyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl , formyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl sulfonyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl or a C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl carbonyl with 1 to 5 ? , Or U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup> becoming simultaneous, 1 to 4 which is chosen from oxygen atom , nitrogen atom or sulfur atom with 7 -member ring , n displays number of substituents from 3 may include heteroatom , with 0 to 4 , p displays quantity of repeated , they are 0 to 2 .

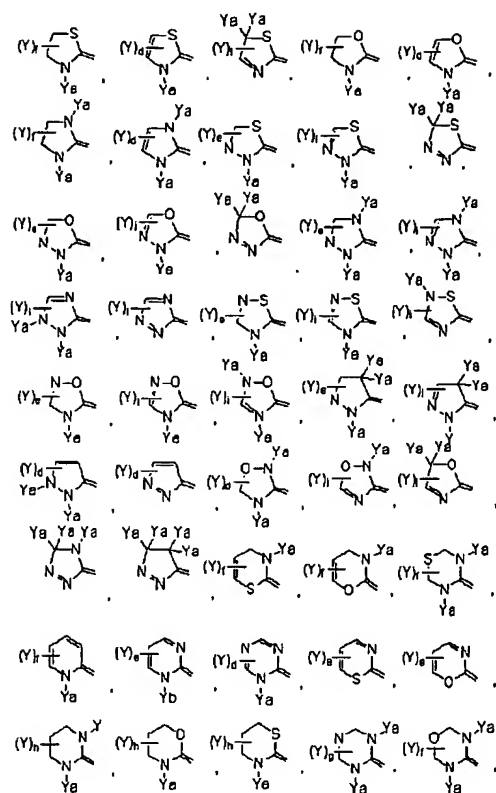
) With heterocyclic ring imino aromatic compound which is displayed or as pesticide acceptable salt .

[0017]

[2] A<sup>1</sup>

[0018]

[Chemical Formula 14]

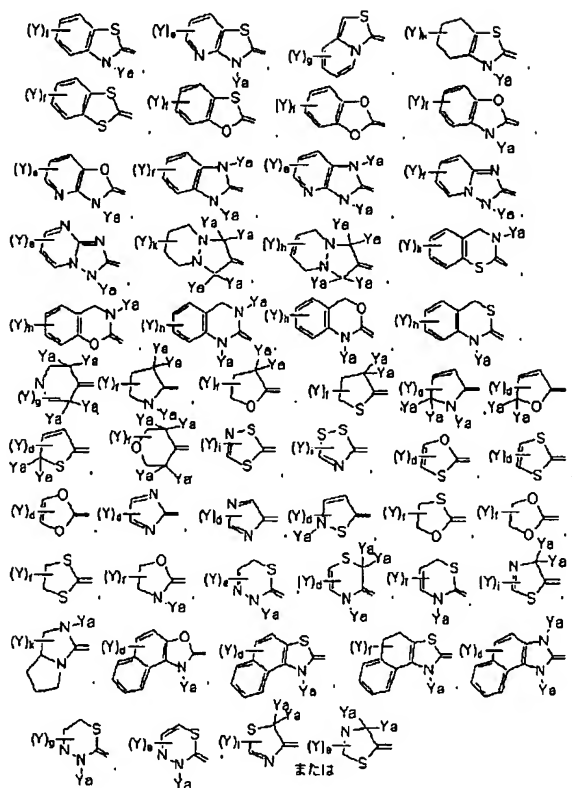


[0019]

[化 15]

[0019]

[Chemical Formula 15]



[0020]

So, d to display number of substituents , with 0 to 2 , e to display number of substituents , with 0 to 3 , f to display number of substituents , with 0 to 4 , g to display number of substituents , with 0 to 5 , h to display the number of substituents , with 0 to 6 , i to display number of substituents , with 0 to 1 , the j to display number of substituents , with 0 - 7, k displays number of substituents , from 0 with 8, Ya and Y are Y\*<sup>-D-</sup> (CH<sub>2</sub> )<sup>-</sup> mutually in independence or, with said carbon atom oxygen atom , nitrogen atom or sulfur atom each 1 - 3 3 - 7 -member ring where it is possible to include or C=Q<sup>1</sup> is formed (However, when total of Ya and Y is 2 or more , the Ya and Y or Ya and Y also identical or different is good mutually. ), with Y or Ya of 2 it substitutes on same carbon atom of A<sup>1</sup> , heterocyclic ring imino aromatic compound Ya has been allowed to have displaced hydrogen atom , in [1] states or as pesticide acceptable salt .

## [0021]

[3] A<sup>1</sup> is displayed heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in [1] or [2] which or 5-member ring heterocyclic ring as pesticide acceptable salt .

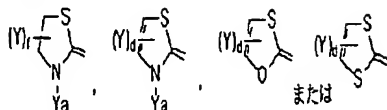


[0022]

[4] A<sup>1</sup> が

[0023]

【化 16】



[0024]

(式中、Y、Ya、d および f は[2]と同様の意味を表す。)を表す[1]び[2]に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

[0025]

[5] Ya および Y は、互いに独立に Y'-D-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-であるか(但し、Ya と Y との合計が 2 個以上の時は、Ya どうし、Y どうしまたは Ya と Y とは互いに同一または異なってもよい。)、A<sup>1</sup> の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y または Ya により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々 1~3 個含んでいてもよい 3~7 員環または C=Q<sup>1</sup> を形成する、[2]、[3]または[4]に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

[0026]

[6] G が G<sup>1</sup> を表す[1]、[2]、[3]、[4]または[5]のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその農薬として許容される塩。

[0027]

[7] 農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシュウ酸塩である[1]、[2]、[3]、[4]、[5]または[6]に記載の塩。

[0028]

[8] [1]、[2]、[3]、[4]、[5]、[6]または[7]に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

[0029]

[9] [1]、[2]、[3]、[4]、[5]、[6]または[7]に記載のヘテロ環イミノ芳香族化合物またはその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

[0022]

[4] A<sup>1</sup>

[0023]

[Chemical Formula 16]

[0024]

(In Formula, Y, Ya, d and f [2] with display similar meaning. ) is displayed, [1] \* heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in [2] or as pesticide acceptable salt .

[0025]

[5] Ya and Y are Y\*-D- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>- mutually in independence or, with said carbon atom oxygen atom , nitrogen atom or sulfur atom each 1 - 3 3 - 7 -member ring where it is possible to include or C=Q<sup>1</sup> is formed (However, when total of Ya and Y is 2 or more , the Ya and Y or Ya and Y also identical or different is good mutually. ), with Y or Ya of 2 it substitutes on same carbon atom of the A<sup>1</sup>, [2], heterocyclic ring imino aromatic compound which is stated in [3] or [4] or as pesticide the acceptable salt .

[0026]

[6] G displays G<sup>1</sup>, [1], [2], [3], as heterocyclic ring imino aromatic compound or pesticide of [4] or [5] acceptable salt .

[0027]

acceptable salt is acetate , hydrobromide , hydroiodide , formate salt , acetate or oxalate as [7] pesticide , [1], [2], [3], [4],[5] or salt . which is stated in [6]

[0028]

[8] [1] [2] [3] [4] [5] [6] Or pesticide . which contains one kind or more which is chosen from heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt which is stated in [7] as active ingredient

[0029]

[9] [1] [2] [3] [4] [5] [6] Or microbicide . which contains one kind or more which is chosen from heterocyclic ring imino aromatic compound or its salt which is stated in [7] as active ingredient

[0030]

但し、本化合物に、立体異性体、幾何異性体、互変異性体、ジアステレオマーが存在する場合には、それぞれの異性体並びにそれらの混合物の全てを包含する。

[0031]

【発明の実施の形態】

式(1)で表される本発明化合物の各置換基を、以下に例示する。

[0032]

なお、略号はそれぞれ以下の意味を示す。

[0033]

Me はメチル基を、Et はエチル基を、Pr はプロピル基を、Bu はブチル基を、Pen はペンチル基を、Hex はヘキシル基を、Hep はヘプチル基を、Oct はオクチル基を、Non はノニル基を、Dec はデシル基を、Undec はウンデカニル基を、Dodec はドデシル基を、n はノーマルを、i はイソを、s はセカンダリーを、t はターシャリーを、c はシクロをそれぞれ表し、Ph はフェニル基を表し、フェニル基の表記において例えば 2-Cl-Ph は 2-クロロフェニル基を表し、2-MeO-3-Me-Ph は 2-メトキシ-3-メチルフェニル基を表す。

[0034]

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{13}, R^{14}, R^a, X^1, X^2, X^3, X^4, U^1$  および  $U^2$  の定義における  $C_1 \sim C_6$  アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチルおよび 4-メチルペンチル等があげられる。

[0035]

$R^5, R^6, R^8, R^9, R^{10}, R^{13}, R^a, R^b, R^c, X^1, X^3, X^4$  および  $Y^1$  の定義におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子があげられる。

[0030]

However, when in this compound, configurational isomer, enantiomer, tautomer, diastereomer exists, respective isomer and all of mixture of those are included.

[0031]

[Embodiment of the Invention]

Each substituent of the compound of this invention which is displayed with Formula (1), is illustrated below.

[0032]

Furthermore, code shows meaning below each one.

[0033]

As for Me methyl group, as for Et ethyl group, as for Pr propyl group, as for Bu butyl group, as for Pen pentyl group, as for Hex hexyl group, as for Hep heptyl group, as for Oct octyl group, as for Non nonyl group, as for Dec decyl group, as for Undec undecanyl group, as for Dodec dodecyl group, as for n normal, as for i iso, as for s secondary, As for t tertiary, as for c you display cyclo respectively, Ph display phenyl group, 2-chlorophenyl group you display the for example 2- Cl-Ph in transcription of phenyl group, 2 -MeO-3- Me-Ph display 2-methoxy -3-methyl phenyl group .

[0034]

As  $C^{1 \sim 6}$  alkyl in defining  $R^{1 \sim 6}$ ,  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{13}, R^{14}, R^a, X^1, X^2, X^3, X^4, U^1$  and  $U^2$ , you can list the methyl, ethyl, n- propyl, i-propyl, n- butyl, i- butyl, t-butyl, s-butyl, n- pentyl, n- hexyl, 2- ethyl propyl, 2, 2- dimethyl propyl, 1, 2- dimethyl propyl, 1, 1, 2- trimethylpropyl, 1, 2, 2- trimethylpropyl, 1- ethyl -1- methylpropyl, 1- ethyl -2- methylpropyl, 1- methyl butyl, 2- methyl butyl, 3- methyl butyl, 1, 1- dimethylbutyl, 1, 2- dimethylbutyl, 1, 3- dimethylbutyl, 2, 2- dimethylbutyl, 2, 3- dimethylbutyl, 3, 3- dimethylbutyl, 1- ethyl butyl, 2- ethyl butyl, 1- methyl pentyl, 2- methyl pentyl, 3- methyl pentyl and 4 -methyl pentyl etc as alkyl of straight chain or branched .

[0035]

It can increase fluorine atom, chlorine atom, bromine atom and iodine atom as halogen atom in defining the  $R^5, R^6, R^8, R^9, R^{10}, R^{13}, R^a, R^b, R^c, X^1, X^3, X^4$  and  $Y^1$ ,  $R^5, R^6, R^8, R^9, R^{10}, R^{13}, R^a, R^b, R^c, X^1, X^3, X^4$  and  $Y^1$ .

素原子があげられる。

【0036】

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>a</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルとしてフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-*i*-プロピル、1-クロロ-*i*-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロ-*n*-プロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フルオロペンチル、6-クロロヘキシルおよび 6-フルオロヘキシル等があげられる。

【0037】

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> シクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル等があげられる。

【0038】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> および X<sup>4</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*i*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、*i*-ブトキシ、*s*-ブトキシ、*t*-ブトキシ、*n*-ペンチルオキシ、*n*-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシおよび 4-メチルペンチルオキシ等があげられる。

R<sup>sup>a</sup></sup>

, R<sup>sup>b</sup>, R<sup>sup>c</sup>, X<sup>sup>1</sup>, X<sup>sup>3</sup>, X<sup>sup>4</sup> and Y\*.</sup></sup></sup></sup></sup>

【0036】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl in defining R<sup>sup>1</sup></sup>

, R<sup>sup>2</sup>, R<sup>sup>3</sup>, R<sup>sup>4</sup>, R<sup>sup>5</sup>, R<sup>sup>6</sup>, R<sup>sup>7</sup>, R<sup>sup>13</sup>, R<sup>sup>14</sup>, R<sup>sup>a</sup>, X<sup>sup>1</sup>, X<sup>sup>2</sup>, X<sup>sup>3</sup>, X<sup>sup>4</sup>, U<sup>sup>1</sup> and U<sup>sup>2</sup>, you can list the fluoromethyl, chloromethyl, bromomethyl, iodomethyl, difluoromethyl, chloro difluoromethyl, bromo difluoromethyl, trifluoromethyl, dichloro methyl, trichloromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-iodoethyl, 1-fluoro ethyl, 2-chloroethyl, 2-bromoethyl, 2-iodoethyl, 2-fluoro ethyl, 2,2-difluoro ethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl, 2,2,2-trifluoro-1-chloroethyl, 3-fluoropropyl, 3-chloropropyl, 1-fluoro-*i*-propyl, 1-chloro-*i*-propyl, heptafluoro propyl, 1,1,2,2,3,3-hexafluoro-*n*-propyl, 4-chloro butyl, 4-fluoro butyl, 5-chloro pentyl, 5-fluoro pentyl, 6-chloro hexyl and 6-fluoro hexyl etc as haloalkyl of straight chain or branched.</sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup>

【0037】

You can list cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl etc as C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub> cycloalkyl in defining the R<sup>sup>1</sup></sup>

, R<sup>sup>2</sup>, R<sup>sup>3</sup>, R<sup>sup>4</sup>, R<sup>sup>5</sup>, R<sup>sup>6</sup>, R<sup>sup>7</sup>, R<sup>sup>13</sup>, R<sup>sup>14</sup>, R<sup>sup>a</sup>, R<sup>sup>b</sup>, U<sup>sup>1</sup> and U<sup>sup>2</sup>.</sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup>

【0038】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy in defining R<sup>sup>5</sup></sup>

, R<sup>sup>6</sup>, R<sup>sup>7</sup>, R<sup>sup>8</sup>, R<sup>sup>9</sup>, R<sup>sup>a</sup>, R<sup>sup>b</sup>, X<sup>sup>1</sup>, X<sup>sup>3</sup> and X<sup>sup>4</sup>, you can list the methoxy, ethoxy, *n*-propoxy, *i*-propoxy, *n*-butoxy, *i*-butoxy, *s*-butoxy, *t*-butoxy, *n*-pentyloxy, *n*-hexyloxy, 1,1-dimethyl propoxy, 1,2-dimethyl propoxy, 2,2-dimethyl propoxy, 1-ethyl propoxy, 1,1,2-trimethyl propoxy, 1,2,2-trimethyl propoxy, 1-ethyl-1-methyl propoxy, 1-ethyl-2-methyl propoxy, 1-methyl butoxy, 2-methyl butoxy, 3-methyl butoxy, 1-ethyl butoxy, 2-ethyl butoxy, 1,1-dimethyl butoxy, 1,2-dimethyl butoxy, 1,3-dimethyl butoxy, 2,2-dimethyl butoxy, 2,3-dimethyl butoxy, 3,3-dimethyl butoxy, 1-methyl pentyloxy, 2-methyl pentyloxy, 3-methyl pentyloxy and 4-methyl pentyloxy etc as alkoxy of straight chain or branched.</sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup>

【0039】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> および X<sup>4</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシとしては、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> 直鎖状または分岐状のハロアルコキシがあげられ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、1-フルオロ-i-プロポキシ、1-クロロ-i-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシおよび 6-フルオロヘキシルオキシ等があげられる。

【0040】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> および X<sup>4</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフェニルとしてメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、n-ペンチルチオおよび n-ヘキシルチオ等があげられる。

【0041】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフィニルとしてメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、i-プロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、i-ブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル、t-ブチルスルフィニル、n-ペンチルスルフィニルおよび n-ヘキシルスルフィニル等があげられる。

【0042】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルホニルとしてメチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、i-プロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、i-ブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル、t-ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニルおよび n-ヘキシルスルホニル等があげられる。

【0039】

It can increase haloalkoxy of C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> straight or branched as C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy in defining the R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> and X<sup>4</sup>, can list fluoro methoxy, chloro methoxy, bromo methoxy, iodo methoxy, dichloro methoxy, trichloro methoxy, difluoro methoxy, trifluoromethoxy, chloro difluoro methoxy, bromo difluoro methoxy, dichloro fluoro methoxy, 1- chloro ethoxy, 1- bromo ethoxy, 1- iodo ethoxy, 1- fluoro ethoxy, 2- chloro ethoxy, 2- bromo ethoxy, 2- iodo ethoxy, 2- fluoro ethoxy, 2, 2- difluoro ethoxy, 2, 2, 2- trifluoro ethoxy, 2, 2, 2- trichloro ethoxy, penta fluoro ethoxy, 2, 2, 2- trifluoro -1- chloro ethoxy, 1, 1, 2, 2- tetrafluoro ethoxy, 3- bromo propoxy, 1- fluoro -i- propoxy, 1- chloro -i- propoxy, 3- fluoro propoxy, 3- chloro propoxy, heptafluoro propoxy, 1, 1, 2, 2, 3, 3- hexafluoro propoxy, 4- chlorobutoxy, 4- fluoro butoxy, 5-chloro pentyloxy, 5-fluoro pentyloxy, 6-chloro hexyloxy and 6 -fluoro hexyloxy etc.

【0040】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulphenyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> and X<sup>4</sup>, you can list the methylthio, ethyl thio, n- propyl thio, i-propyl thio, n- butyl thio, i- butyl thio, s-butyl thio, t-butyl thio, n- pentyl thio and n- hexylthio etc as alkyl sulphenyl of straight chain or branched .

【0041】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the methyl sulfinyl, ethyl sulfinyl, n- propyl sulfinyl, i-propyl sulfinyl, n- butyl sulfinyl, i- butyl sulfinyl, s-butyl sulfinyl, t-butyl sulfinyl, n- pentyl sulfinyl and n- hexyl sulfinyl etc as alkyl sulfinyl of straight chain or branched .

【0042】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list the methyl sulfonyl, ethyl sulfonyl, n- propyl sulfonyl, i-propyl sulfonyl, n- butyl sulfonyl, i- butyl sulfonyl, s-butyl sulfonyl, t-butyl sulfonyl,

ル、t-ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニルおよびn-ヘキシルスルホニル等があげられる。

【0043】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>a</sup>、U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、i-プロポキシメチル、n-ブトキシメチル、i-ブトキシメチル、s-ブトキシメチル、t-ブトキシメチル、n-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピルおよび3-メトキシプロピル等があげられる。

【0044】

R<sup>b</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシとしては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、i-プロポキシメトキシ、n-ブトキシメトキシ、i-ブトキシメトキシ、s-ブトキシメトキシ、t-ブトキシメトキシ、n-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシおよび3-メトキシプロポキシ等があげられる。

【0045】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>a</sup>、U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖状または分岐状のアルキルスルフェニルアルキルとして、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピルおよび3-メチルチオプロピル等があげられる。

【0046】

R<sup>b</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシとしては、メチルチオメトキシ、エチルチオメトキシ、n-プロピルチオメトキシ、i-プロピルチオメトキシ、n-ブチルチオメトキシ、i-ブチルチオメトキシ、s-ブチルチオメトキシ、t-ブチルチオメトキシ、n-ペンチルチオメトキシ、2-メチルチオエトキシ、3-エチルチオプロポキシおよび3-メチルチオプロポキシ等があげられる。

【0047】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフェニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルチオとしてフルオロメチ

n- pentyl sulfonyl and n- hexyl sulfonyl etc as alkyl sulfonyl of straight chain or branched .

【0043】

You can list methoxymethyl , ethoxymethyl , n- propoxy methyl , i- propoxy methyl , n- butoxy methyl , i- butoxy methyl , s-butoxy methyl , t-butoxy methyl , n- pentyloxy methyl , 2- methoxyethyl , 3- ethoxy propyl and 3 -methoxypropyl etc as

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl in defining the

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> ,

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> ,

R<sup>7</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>a</sup> ,

U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup> .

【0044】

You can list methoxy methoxy , ethoxy methoxy , n- propoxy methoxy , i- propoxy methoxy , n- butoxy methoxy , i- butoxy methoxy , s-butoxy methoxy , t-butoxy methoxy , n- pentyloxy methoxy , 2- methoxy ethoxy , 3- ethoxy propoxy and 3 -methoxy propoxy etc as

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy in defining the

R<sup>b</sup> .

【0045】

You can list methylthio methyl , ethyl thio methyl , n- propyl thio methyl , i-propyl thio methyl , n- butyl thio methyl , i- butyl thio methyl , s-butyl thio methyl , t-butyl thio methyl , n- pentyl thio methyl , 2- methylthio ethyl , 3- ethyl thio propyl , and 3 -methylthio propyl etc as alkyl sulfenyl alkyl of straight or branched as C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl in defining R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> , R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> , R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup> , U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup> .

【0046】

You can list methylthio methoxy , ethyl thio methoxy , n- propyl thio methoxy , i-propyl thio methoxy , n- butyl thio methoxy , i- butyl thio methoxy , s-butyl thio methoxy , t-butyl thio methoxy , n- pentyl thio methoxy , 2- methylthio ethoxy , 3- ethyl thio propoxy and 3 -methylthio propoxy etc as C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy in defining the

R<sup>b</sup> .

【0047】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl sulfenyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the fluoromethyl thio ,

chloro difluoromethyl thio , bromo difluoromethyl thio , trifluoromethyl thio , trichloromethyl thio , 2, 2, 2-trifluoroethyl thio , 1, 1, 2, 2-tetrafluoroethyl thio , 2- fluoro ethyl thio , pentafluoroethyl thio and 1 -fluoro -i-propyl thio etc as haloalkyl thio of straight or branched .

[0048]

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the fluoromethyl sulfinyl, chloro difluoromethyl sulfinyl, bromo difluoromethyl sulfinyl, trifluoromethyl sulfinyl, trichloromethyl sulfinyl, 2, 2, 2- trifluoroethyl sulfinyl, 1, 1, 2, 2- tetrafluoroethyl sulfinyl, 2- fluoro ethyl sulfinyl, pentafluoroethyl sulfinyl and 1 -fluoro -i-propyl sulfinyl etc as haloalkyl sulfinyl of straight or branched.

## [0049]

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list the fluoromethyl sulfonyl, chloro difluoromethyl sulfonyl, bromo difluoromethyl sulfonyl, trifluoromethyl sulfonyl, trichloromethyl sulfonyl, 2, 2, 2- trifluoroethyl sulfonyl, 1, 1, 2, 2- tetrafluoroethyl sulfonyl, 2- fluoro ethyl sulfonyl, pentafluoroethyl sulfonyl and 1 -fluoro -i-propyl sulfonyl etc as haloalkyl sulfonyl of straight or branched.

[0050]

As C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> and R<sup>a</sup>, you can list the ethenyl, 1- propenyl, 2- propenyl, 1- butenyl, 2- butenyl, 3- butenyl, 1- pentenyl, 2- pentenyl, 3- pentenyl, 4- pentenyl, 1- hexenyl, 2- hexenyl, 3- hexenyl, 4- hexenyl, 5-hexenyl, 1- methyl -2- propenyl, 2- methyl -2- propenyl, 1, 1- dimethyl -2- propenyl, 1, 2- dimethyl -2- propenyl, 1- ethyl -2- propenyl, 1- methyl -2- butenyl, 2- methyl -2- butenyl, 3- methyl -2- butenyl, 1- methyl -3- butenyl, 2- methyl -3- butenyl, 3- methyl -3- butenyl, 1, 1- dimethyl -2- butenyl, 1, 1- dimethyl -3- butenyl, 1, 2- dimethyl -2- butenyl, 1, 2- dimethyl -3- butenyl, 1, 3- dimethyl -2- butenyl, 1, 3- dimethyl -3- butenyl, 2, 3- dimethyl -2- butenyl, 2, 3- dimethyl -3- butenyl, 1- ethyl -2- butenyl, 1- ethyl -3- butenyl, 2- ethyl -2- butenyl, 2- ethyl -3- butenyl, 1- methyl -2- pentenyl, 2- methyl -2- pentenyl, 3- methyl -2- pentenyl, 4- methyl -2- pentenyl, 1- methyl -3- pentenyl, 2- methyl -3- pentenyl, 3-

ル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニルおよび 1-エチル-1-メチル-2-プロペニル等が挙げられる。

## 【0051】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{14}$  および  $R^a$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  ハロアルケニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルとして 2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

## 【0052】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^a$  および  $R^b$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  アルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルケニルオキシとして 1-メチルエテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-メチル-2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシおよび 2-メチル-2-プロペニルオキシ等があげられる。

## 【0053】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^a$ 、 $R^b$  および  $X$  およびの定義における  $C_2 \sim C_6$  ハロアルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルオキシとして 2-クロロエテニルオキシ、2-ブロモエテニルオキシ、2,2-ジクロロエテニルオキシ、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3-フルオロ-2-プロペニルオキシ、3-ブロモ-2-プロペニルオキシ、3-ヨード-2-プロペニルオキシ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルオキシおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等が挙げられる。

## 【0054】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^a$  および  $R^b$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  アルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフェニルとして 1-メチルエテニルチオ、2-プロペニルチオ、1-メチル-2-プロペニルチオ、2-ブテニルチオ、3-ブテニルチオおよび 2-メチル-2-プロペニルチオ等があげられる。

## 【0055】

methyl -3- pentenyl , 4- methyl -3- pentenyl , 1- methyl -4- pentenyl , 2- methyl -4- pentenyl , 3- methyl -4- pentenyl , 4- methyl -4- pentenyl , 1, 1, 2- trimethyl -2- propenyl and 1 -ethyl -1- methyl -2- propenyl etc as alkenyl of straight chain or branched .

## 【0051】

As  $C_{2 \sim 6}$  haloalkenyl in defining  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^{14}$  and  $R^a$ , you can list 2-chloro ethenyl , 2- bromo ethenyl , 2, 2- dichloro ethenyl , 3- chloro -2- propenyl , 3- fluoro -2- propenyl , 3- bromo -2- propenyl , 3- iodo -2- propenyl , 3, 3- dichloro -2- propenyl , 3, 3- difluoro -2- propenyl , 4- chloro -2- butenyl , 4, 4- dichloro -3- butenyl and 4 and 4 -difluoro -3- butenyl etc as haloalkenyl of straight chain or branched .

## 【0052】

As  $C_{2 \sim 6}$  alkenyl oxy in defining  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^a$  and  $R^b$ , you can list 1-methyl ethenyl oxy , 2- propenyl oxy , 1- methyl -2- propenyl oxy , 2- butenyl oxy , 3- butenyl oxy and 2- methyl -2- propenyl oxy etc as alkenyl oxy of straight chain or branched .

## 【0053】

As  $C_{2 \sim 6}$  haloalkenyloxy in defining  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^a$ ,  $R^b$  and  $X$  and, you can list 2-chloro ethenyl oxy , 2- bromo ethenyl oxy , 2, 2- dichloro ethenyl oxy , 3- chloro -2- propenyl oxy , 3- fluoro -2- propenyl oxy , 3- bromo -2- propenyl oxy , 3- iodo -2- propenyl oxy , 3, 3- dichloro -2- propenyl oxy , 3, 3- difluoro -2- propenyl oxy , 4- chloro -2- butenyl oxy , 4, 4- dichloro -3- butenyl oxy and 4 and 4 -difluoro -3- butenyl oxy etc as haloalkenyloxy of straight chain or branched .

## 【0054】

As  $C_{2 \sim 6}$  alkenyl sulfenyl in defining  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^a$  and  $R^b$ , you can list 1-methyl ethenyl thio , 2- propenyl thio , 1- methyl -2- propenyl thio , 2- butenyl thio , 3- butenyl thio and 2- methyl -2- propenyl thio etc as alkenyl sulfenyl of straight chain or branched .

## 【0055】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフィニルとして 1-メチルエテニルスルフィニル、2-プロペニルスルフィニル、1-メチル-2-プロペニルスルフィニル、2-ブテニルスルフィニル、3-ブテニルスルフィニルおよび 2-メチル-2-プロペニルスルフィニル等があげられる。

## [0056]

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルホニルとして 1-メチルエテニルスルホニル、2-プロペニルスルホニル、1-メチル-2-プロペニルスルホニル、2-ブテニルスルホニル、3-ブテニルスルホニルおよび 2-メチル-2-プロペニルスルホニル等があげられる。

## [0057]

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフェニルとして 2-クロロエテニルチオ、2-ブロモエテニルチオ、2,2-ジクロロエテニルチオ、3-クロロ-2-プロペニルチオ、3-フルオロ-2-プロペニルチオ、3-ブロモ-2-プロペニルチオ、3-ヨード-2-プロペニルチオ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルチオ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルチオ、4-クロロ-2-ブテニルチオ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルチオおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニルチオ等が挙げられる。

## [0058]

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフィニルとして 2-クロロエテニルスルフィニル、2-ブロモエテニルスルフィニル、2,2-ジクロロエテニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロペニルスルフィニル、3-フルオロ-2-プロペニルスルフィニル、3-ブロモ-2-プロペニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルフィニル、4-クロロ-2-ブテニルスルフィニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルスルフィニルおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニルスルフィニル等が挙げられる。

## [0059]

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルホニルとして 2-クロロエテニルスルホニル、2-ブロモエテニルスルホニル、2,2-ジクロロエテニルスルホニル、3-クロロ-2-プロペニルスルホニル、3-フルオロ-2-プロ

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list 1-methyl ethenyl sulfinyl, 2-propenyl sulfinyl, 1-methyl-2-propenyl sulfinyl, 2-butenyl sulfinyl, 3-butenyl sulfinyl and 2-methyl-2-propenyl sulfinyl etc as alkenyl sulfinyl of straight chain or branched.

## [0056]

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list 1-methyl ethenyl sulfonyl, 2-propenyl sulfonyl, 1-methyl-2-propenyl sulfonyl, 2-butenyl sulfonyl, 3-butenyl sulfonyl and 2-methyl-2-propenyl sulfonyl etc as alkenyl sulfonyl of straight chain or branched.

## [0057]

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list 2-chloro ethenyl thio, 2-bromo ethenyl thio, 2,2-dichloro ethenyl thio, 3-chloro-2-propenyl thio, 3-fluoro-2-propenyl thio, 3-bromo-2-propenyl thio, 3-iodo-2-propenyl thio, 3,3-dichloro-2-propenyl thio, 3,3-difluoro-2-propenyl thio, 4-chloro-2-butenyl thio, 4,4-dichloro-3-butenyl thio and 4,4-difluoro-3-butenyl thio etc as haloalkenyl sulfinyl of straight chain or branched.

## [0058]

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list 2-chloro ethenyl sulfinyl, 2-bromo ethenyl sulfinyl, 2,2-dichloro ethenyl sulfinyl, 3-chloro-2-propenyl sulfinyl, 3-fluoro-2-propenyl sulfinyl, 3-bromo-2-propenyl sulfinyl, 3-iodo-2-propenyl sulfinyl, 3,3-dichloro-2-propenyl sulfinyl, 3,3-difluoro-2-propenyl sulfinyl, 4-chloro-2-butenyl sulfinyl, 4,4-dichloro-3-butenyl sulfinyl and 4,4-difluoro-3-butenyl sulfinyl etc as haloalkenyl sulfinyl of straight chain or branched.

## [0059]

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkenyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list 2-chloro ethenyl sulfonyl, 2-bromo ethenyl sulfonyl, 2,2-dichloro ethenyl sulfonyl, 3-chloro-2-propenyl sulfonyl, 3-fluoro-2-propenyl sulfonyl, 3-bromo-2-propenyl sulfonyl, 3-iodo-2-propenyl



ペニルスルホニル、3-プロモ-2-プロペニルスルホニル、3-ヨード-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルホニル、4-クロロ-2-ブテニルスルホニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルスルホニルおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニルスルホニル等が挙げられる。

【0060】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$  および  $R^a$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニルおよびヘキシニル等があげられる。

【0061】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{14}$  および  $R^a$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  ハロアルキニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルとしてクロロエチニル、プロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-プロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび 6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

【0062】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^a$  および  $R^b$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  アルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキニルオキシとしてエチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ、1,1-ジメチル-2-プロピニルオキシ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ、1-メチル-2-ブチニルオキシ、1,1-ジメチル-2-ブチニルオキシ、1-ペンチニルオキシ、2-ペンチニルオキシ、3-ペンチニルオキシ、4-ペンチニルオキシおよびヘキシニルオキシ等があげられる。

【0063】

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^a$  および  $R^b$  の定義における  $C_2 \sim C_6$  ハロアルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルオキシとしてクロロエチニルオキシ、プロモエチニルオキシ、ヨードエチニル

sulfonyl, 3, 3- dichloro -2- propenyl sulfonyl, 3, 3- difluoro -2- propenyl sulfonyl, 4- chloro -2- butenyl sulfonyl, 4, 4- dichloro -3- butenyl sulfonyl and 4 and 4 -difluoro -3- butenyl sulfonyl etc as haloalkenyl sulfonyl of straight chain or branched .

【0060】

As  $C_{2 \sim 6}$  alkynyl in defining  $R^{5 \sim 13}$ ,  $R^{14}$  and  $R^a$ , you can list the ethynyl, 1- propynyl, 2- propynyl, 1- methyl -2- propynyl, 1, 1- dimethyl -2- propynyl, 1- methyl -1- ethyl -2- propynyl, 1- butynyl, 2- butynyl, 3- butynyl, 1- methyl -2- butynyl, 1- methyl -3- butynyl, 2- methyl -3- butynyl, 1, 1- dimethyl -2- butynyl, 1, 1- dimethyl -3- butynyl, 1, 2- dimethyl -3- butynyl, 2, 2- dimethyl -3- butynyl, 1- ethyl -2- butynyl, 1- ethyl -3- butynyl, 2- ethyl -3- butynyl, 1- pentynyl, 2- pentynyl, 3- pentynyl, 4- pentynyl, 1- methyl -3- pentynyl, 1- methyl -4- pentynyl, 2- methyl -3- pentynyl, 2- methyl -4- pentynyl, 3- methyl -4- pentynyl, 4- methyl -2- pentynyl and hexynyl etc as alkynyl of straight chain or branched .

【0061】

As  $C_{2 \sim 6}$  haloalkynyl in defining  $R^{5 \sim 14}$  and  $R^a$ , you can list the chloro ethynyl, bromo ethynyl, iodo ethynyl, 3- chloro -2- propynyl, 3- bromo -2- propynyl, 3- iodo -2- propynyl, 4- bromo -3- butynyl, 4- iodo -3- butynyl and 6 -iodo -5-hexynyl etc as haloalkynyl of straight chain or branched .

【0062】

As  $C_{2 \sim 6}$  alkynyl oxy in defining  $R^{5 \sim 14}$  and  $R^b$ , you can list the ethynyl oxy, 2- propynyl oxy, 1- methyl -2- propynyl oxy, 1, 1- dimethyl -2- propynyl oxy, 1- methyl -1- ethyl -2- propynyl oxy, 2- butynyl oxy, 3- butynyl oxy, 1- methyl -2- butynyl oxy, 1, 1- dimethyl -2- butynyl oxy, 1- pentynyl oxy, 2- pentynyl oxy, 3- pentynyl oxy, 4- pentynyl oxy and hexynyl oxy etc as alkynyl oxy of straight chain or branched .

【0063】

As  $C_{2 \sim 6}$  haloalkynyloxy in defining  $R^{5 \sim 14}$  and  $R^b$ , you can list the chloro ethynyl oxy, bromo ethynyl oxy, iodo ethynyl oxy, 3- chloro -2- propynyl

オキシ、3-クロロ-2-プロピニルオキシ、3-ブロモ-2-プロピニルオキシ、3-ヨード-2-プロピニルオキシ、4-ブロモ-3-ブチニルオキシ、4-ヨード-3-ブチニルオキシおよび 6-ヨード-5-ヘキシニルオキシ等があげられる。

【0064】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフェニルとしてエチニルチオ、2-プロピニルチオ、1-メチル-2-プロピニルチオ、1,1-ジメチル-2-プロピニルチオ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルチオ、2-ブチニルチオ、3-ブチニルチオ、1-メチル-2-ブチニルチオ、1,1-ジメチル-2-ブチニルチオ、1-ペンチニルチオ、2-ペンチニルチオ、3-ペンチニルチオ、4-ペンチニルチオおよびヘキシニルチオ等があげられる。

【0065】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフィニルとしてエチニルスルフィニル、2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-2-プロピニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルフィニル、2-ブチニルスルフィニル、3-ブチニルスルフィニル、1-メチル-2-ブチニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルフィニル、1-ペンチニルスルフィニル、2-ペンチニルスルフィニル、3-ペンチニルスルフィニル、4-ペンチニルスルフィニルおよびヘキシニルスルフィニル等があげられる。

【0066】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルホニルとしてエチニルスルホニル、2-プロピニルスルホニル、1-メチル-2-プロピニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルホニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルホニル、2-ブチニルスルホニル、3-ブチニルスルホニル、1-メチル-2-ブチニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルホニル、1-ペンチニルスルホニル、2-ペンチニルスルホニル、3-ペンチニルスルホニル、4-ペンチニルスルホニルおよびヘキシニルスルホニル等があげられる。

【0067】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフェニルとしてクロロエチニルチオ、ブロモエチニルチオ、ヨードエチニルチオ、3-クロロ-2-プロピニルチオ、3-ブ

oxy, 3-bromo-2-propynyl oxy, 3-iodo-2-propynyl oxy, 4-bromo-3-butynyl oxy, 4-iodo-3-butynyl oxy and 6-iodo-5-hexynyl oxy etc as haloalkynyl oxy of straight chain or branched.

【0064】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfenyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the ethynyl thio, 2-propynyl thio, 1-methyl-2-propynyl thio, 1,1-dimethyl-2-propynyl thio, 1-methyl-1-ethyl-2-propynyl thio, 2-butynyl thio, 3-butynyl thio, 1-methyl-2-butynyl thio, 1,1-dimethyl-2-butynyl thio, 1-pentynyl thio, 2-pentynyl thio, 3-pentynyl thio, 4-pentynyl thio and hexynyl thio etc as alkynyl sulfenyl of straight chain or branched.

【0065】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the ethynyl sulfinyl, 2-propynyl sulfinyl, 1-methyl-2-propynyl sulfinyl, 1,1-dimethyl-2-propynyl sulfinyl, 1-methyl-1-ethyl-2-propynyl sulfinyl, 2-butynyl sulfinyl, 3-butynyl sulfinyl, 1-methyl-2-butynyl sulfinyl, 1,1-dimethyl-2-butynyl sulfinyl, 1-pentynyl sulfinyl, 2-pentynyl sulfinyl, 3-pentynyl sulfinyl, 4-pentynyl sulfinyl and hexynyl sulfinyl etc as alkynyl sulfinyl of straight chain or branched.

【0066】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> alkynyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the ethynyl sulfonyl, 2-propynyl sulfonyl, 1-methyl-2-propynyl sulfonyl, 1,1-dimethyl-2-propynyl sulfonyl, 1-methyl-1-ethyl-2-propynyl sulfonyl, 2-butynyl sulfonyl, 3-butynyl sulfonyl, 1-methyl-2-butynyl sulfonyl, 1,1-dimethyl-2-butynyl sulfonyl, 1-pentynyl sulfonyl, 2-pentynyl sulfonyl, 3-pentynyl sulfonyl, 4-pentynyl sulfonyl and hexynyl sulfonyl etc as alkynyl sulfonyl of straight chain or branched.

【0067】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfenyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the chloro ethynyl thio, bromo ethynyl thio, iodo ethynyl thio, 3-chloro-2-propynyl thio, 3-bromo-2-propynyl thio, 3-iodo-2-propynyl thio, 4-

ロモ-2-プロピニルチオ、3-ヨード-2-プロピニルチオ、4-ブロモ-3-ブチニルチオ、4-ヨード-3-ブチニルチオおよび 6-ヨード-5-ヘキシニルチオ等があげられる。

【0068】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフィニルとしてクロロエチニルスルフィニル、ブロモエチニルスルフィニル、ヨードエチニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロピニルスルフィニル、3-ブロモ-2-プロピニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロピニルスルフィニル、4-ブロモ-3-ブチニルスルフィニル、4-ヨード-3-ブチニルスルフィニルおよび 6-ヨード-5-ヘキシニルスルフィニル等があげられる。

【0069】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の定義における C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルホニルとしてクロロエチニルスルホニル、ブロモエチニルスルホニル、ヨードエチニルスルホニル、3-クロロ-2-プロピニルスルホニル、3-ブロモ-2-プロピニルスルホニル、3-ヨード-2-プロピニルスルホニル、4-ブロモ-3-ブチニルスルホニル、4-ヨード-3-ブチニルスルホニルおよび 6-ヨード-5-ヘキシニルスルホニル等があげられる。

【0070】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルコキシカルボニルとしてメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニルおよび n-ヘキシルオキシカルボニル等が挙げられる。

【0071】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルとしてアセチル、プロピオニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、i-ブチルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、n-ペンチルカルボニルおよび n-ヘキシルカルボニル等があげられる。

【0072】

bromo -3- butynyl thio , 4- iodo -3- butynyl thio and 6 -iodo -5-hexynyl thio etc as haloalkynyl sulfinyl of straight chain or branched .

【0068】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfinyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the chloro ethynyl sulfinyl , bromo ethynyl sulfinyl , iodo ethynyl sulfinyl , 3- chloro -2- propynyl sulfinyl , 3- bromo -2- propynyl sulfinyl , 3- iodo -2- propynyl sulfinyl , 4- bromo -3- butynyl sulfinyl , 4- iodo -3- butynyl sulfinyl and 6 -iodo -5-hexynyl sulfinyl etc as haloalkynyl sulfinyl of straight chain or branched .

【0069】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> haloalkynyl sulfonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup> and R<sup>b</sup>, you can list the chloro ethynyl sulfonyl , bromo ethynyl sulfonyl , iodo ethynyl sulfonyl , 3- chloro -2- propynyl sulfonyl , 3- bromo -2- propynyl sulfonyl , 3- iodo -2- propynyl sulfonyl , 4- bromo -3- butynyl sulfonyl , 4- iodo -3- butynyl sulfonyl and 6 -iodo -5-hexynyl sulfonyl etc as haloalkynyl sulfonyl of straight chain or branched .

【0070】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list the methoxycarbonyl , ethoxy carbonyl , n- propoxy carbonyl , i- propoxy carbonyl , n- butoxy carbonyl , i- butoxy carbonyl , s-butoxy carbonyl , t-butoxycarbonyl , n- pentyloxy carbonyl and n- hexyloxy carbonyl etc as alkoxy carbonyl of straight chain or branched .

【0071】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list the acetyl , propanoyl , n- propyl carbonyl , i-propyl carbonyl , n- butyl carbonyl , i- butyl carbonyl , s-butyl carbonyl , t-butyl carbonyl , n- pentyl carbonyl and n- hexyl carbonyl etc as alkyl carbonyl of straight chain or branched .

【0072】

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> のハロアルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルカルボニルとしてクロロアセチル、フルオロアセチル、クロロフルオロアセチル、クロロジフルオロアセチル、ジクロロアセチル、ジフルオロアセチル、トリフルオロアセチル、3,3,3-トリフルオロプロピオニルおよびペンタフルオロプロピオニル等があげられる。

[0073]

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルオキシとしてアセチルオキシ、プロピオニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、s-ブチルカルボニルオキシ、t-ブチルカルボニルオキシ、n-ペンチルカルボニルオキシおよび n-ヘキシルカルボニルオキシ等があげられる。

[0074]

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> および R<sup>c</sup> の定義における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロ

As haloalkyl carbonyl of C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list chloroacetyl, fluoro acetyl, chloro fluoro acetyl, chloro difluoro acetyl, dichloro acetyl, difluoro acetyl, trifluoroacetyl, 3, 3, 3- trifluoro propanoyl and penta fluoro propanoyl etc as haloalkyl carbonyl of straight chain or branched.

[0073]

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list the acetyl oxy, propanoyl oxy, n- propyl carbonyl oxy, i-propyl carbonyl oxy, n- butyl carbonyl oxy, i- butyl carbonyl oxy, s-butyl carbonyl oxy, t-butyl carbonyl oxy, n- pentyl carbonyl oxy and n- hexyl carbonyl oxy etc as alkyl carbonyl oxy of straight chain or branched.

[0074]

benzyl, 2- chloro benzyl, 3- bromo benzyl, 4- chloro benzyl, 4- methylbenzyl, 4- t-butyl benzyl, 2- methylbenzyl, 2- methoxy benzyl, 1- phenylethyl, 1- (3- chlorophenyl ) ethyl, 2- phenylethyl, 1- methyl -1- phenylethyl, 1- (4- chlorophenyl ) - 1- methylethyl, 1- (3- chlorophenyl ) - 1- methylethyl, 1- phenyl propyl, 2- phenyl propyl, 3- phenyl propyl, 1- phenyl butyl, 2- phenyl butyl, 3- phenyl butyl, 4- phenyl butyl, 1- methyl -1- phenyl propyl, 1- methyl -2- phenyl propyl, 1- methyl -3- phenyl propyl, 2- methyl -2- phenyl propyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2- methylpropyl, 2- methyl -2- (3- methylphenyl ) propyl, 1- phenyl pentyl, 2- phenyl pentyl, 3- phenyl pentyl, 4- phenyl pentyl, 5-phenyl pentyl, 1- methyl -1- phenyl butyl, 1- methyl -2- phenyl butyl, 1- methyl -3- phenyl butyl, 1- methyl -4- phenyl butyl, 2- methyl -2- phenyl butyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2- methyl butyl, 2- methyl -2- (3- methylphenyl ) butyl, 1- phenyl hexyl, 2- phenyl hexyl, 3- phenyl hexyl, 4- phenyl hexyl, 5-phenyl hexyl, 6-phenyl hexyl, 1- methyl -1- phenyl pentyl, 1- methyl -2- phenyl pentyl, 1- methyl -3- phenyl pentyl, 1- methyl -4- phenyl pentyl, 2- methyl -2- phenyl pentyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2- methyl pentyl and 2- methyl -2- you can list (3- methylphenyl ) pentyl etc as phenyl alkyl of straight chain or branched as optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl with the R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, in defining R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>.

ロフェニル)-2-メチルペンチルおよび 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

【0075】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>c</sup>の定義における R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

【0076】

R<sup>3</sup>、

R<sup>5</sup>、

R<sup>6</sup>、

R<sup>7</sup>、

R<sup>b</sup>、

R<sup>c</sup>、

X<sup>1</sup>、

X<sup>2</sup>、

X<sup>3</sup> および X<sup>4</sup> の定義における R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルとしては、

Ph、

2-Cl-Ph、

3-Cl-Ph、

4-Cl-Ph、

2-F-Ph、

3-F-Ph、

4-F-Ph、

2-Me-Ph、

3-Me-Ph、

4-Me-Ph、

2-MeO-Ph、

3-MeO-Ph、

4-MeO-Ph、

4-Br-Ph、

[0075]

As optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl with R<sup>a</sup> in defining R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> and R<sup>c</sup>, you can list pyridine -2- yl methyl, 5-chloro thiophene -2- yl methyl, 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl, 2- (3- methyl furan -2- yl ) ethyl, 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl, 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl, 5- (1, 2 and 4 -triazole -1- yl ) pentyl, 6- (pyrrole -1- yl ) hexyl etc as heteroaryl alkyl of straight chain or branched .

[0076]

R<sup>3</sup>、

R<sup>5</sup>、

R<sup>6</sup>、

R<sup>7</sup>、

R<sup>b</sup>、

R<sup>c</sup>、

X<sup>1</sup>、

X<sup>2</sup>、

With R<sup>a</sup> in defining X<sup>3</sup> and X<sup>4</sup> as optionally substitutable phenyl ,

Ph、

2 -Cl-Ph、

3 -Cl-Ph、

4 -Cl-Ph、

2 -F-Ph、

3 -F-Ph、

4 -F-Ph、

2 -Me-Ph、

3 -Me-Ph、

4 -Me-Ph、

2 -MeO-Ph、

3 -MeO-Ph、

4 -MeO-Ph、

4 -Br-Ph、

2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 -Cl <sub>2</sub> -Ph、
3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 -Cl <sub>2</sub> -Ph、
2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph、	2, 4 and 6 -Cl <sub>3</sub> -Ph、
3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph、
2-Cl-4-Me-Ph、	2 -Cl-4- Me-Ph、
2-MeO-4-Me-Ph、	2 -MeO-4- Me-Ph、
2-Cl-4-i-PrO-Ph、	2 -Cl-4- i- PrO-Ph、
3-Cl-4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph、	3 -Cl-4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph、
2,4-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 -Me <sub>2</sub> -Ph、
2,5-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -Me <sub>2</sub> -Ph、
2,6-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -Ph、
2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph、	2, 3, 4, 5 and 6 -F <sub>5</sub> -Ph、
4-Et-Ph、	4 -Et-Ph、
4-i-Pr-Ph、	4 -i- Pr-Ph、
4-n-Bu-Ph、	4 -n- Bu-Ph、
4-s-Bu-Ph、	4 -s-Bu-Ph、
4-t-Bu-Ph、	4 -t-Bu-Ph、
4-(t-BuCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (t-BuCH <sub>2</sub> ) -Ph、
4-Et(Me) <sub>2</sub> -Ph、	4 -Et (Me ) <sub>2</sub> -Ph、
4-n-Hex-Ph、	4 -n- Hex-Ph、
4-((Me) <sub>2</sub> (CN)C)-Ph、	4 - (Me ) <sub>2</sub> (CN ) C -Ph、
4-(MeCH=CH)-Ph、	4 - (MeCH=CH ) -Ph、
4-(MeC≡C)-Ph、	4 - (MeC≡C ) -Ph、
4-CF <sub>3</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> -Ph、
4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph、
4-(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> ) -Ph、
4-(BrC≡C)-Ph、	4 - (BrC≡C ) -Ph、
4-(2,2-F <sub>2</sub> -c-BuCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (2 and 2 -F <sub>2</sub> -c-BuCH <sub>2</sub> ) -Ph、
4-(1-Me-c-Pr)-Ph、	4 - (1 -Me-c-Pr ) -Ph、
4-i-PrO-Ph、	4 -i- PrO-Ph、
4-t-BuO-Ph、	4 -t-BuO-Ph、
4-n-HexO-Ph、	4 -n- HexO-Ph、
4-MeCC(O)Ph、	4 -MeCC (O ) Ph、
4-(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O)-Ph、	4 - (CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O ) -Ph、
4-CHF <sub>2</sub> O-Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> O-Ph、

4-CBrF<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>O-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(CF<sub>2</sub>=CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-Ph、

4-CCl<sub>3</sub>CCH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-MeS-Ph、  
 4-s-BuS-Ph、  
 4-EtSO-Ph、  
 4-MeSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-EtSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-i-PrSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-t-BuSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-(MeCH=CHCH<sub>2</sub>S)-Ph、  
 4-(CH<sub>2</sub>=CHCH<sub>2</sub>SO)-Ph、  
 4-(ClCH=CHCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>)-Ph、  
 4-(HC≡CCH<sub>2</sub>S)-Ph、  
 4-(HC≡CCH<sub>2</sub>SO)-Ph、  
 4-(HC≡CCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>)-Ph、  
 4-CHF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-CBrF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>S-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-CHF<sub>2</sub>SO-Ph、  
 4-CBrF<sub>2</sub>SO-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>SO-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-CHF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-CBrF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-(Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>S)-Ph、  
 4-(Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>SO)-Ph、  
 4-(Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>)-Ph、

4 -CBrF<sub>2</sub>O-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>O-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4 -  
 (CF<sub>2</sub>=CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O )  
 -Ph、  
 4 -CCl<sub>3</sub>CCH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4 -MeS-Ph、  
 4 -s-BuS-Ph、  
 4 -EtSO-Ph、  
 4 -MeSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -EtSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -i- PrSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -t-BuSO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 - (MeCH=CHCH<sub>2</sub>S ) -Ph、  
 4 - (CH<sub>2</sub>=CHCH<sub>2</sub>SO ) -Ph、  
 4 - (ClCH=CHCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub> ) -Ph、  
 4 - (HC \*CCH<sub>2</sub>S ) -Ph、  
 4 - (HC \*CCH<sub>2</sub>SO-Ph )  
 4 - (HC \*CCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub> ) -Ph、  
 4 -CHF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4 -CBrF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>S-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S-Ph、  
 4 -CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>S-Ph、  
 4 -CHF<sub>2</sub>SO-Ph、  
 4 -CBrF<sub>2</sub>SO-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>SO-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -CHF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -CBrF<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 -CF<sub>3</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4 - (Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>S ) -Ph、  
 4 - (Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>SO ) -Ph、  
 4 -  
 (Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub> )

4-(BrC≡CCH<sub>2</sub>S)-Ph、  
 4-(BrC≡CCH<sub>2</sub>SO)-Ph、  
 4-(BrC≡CCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>)-Ph、  
 4-CHO-Ph、  
 4-NO<sub>2</sub>-Ph、  
 3-CN-Ph、  
 4-CN-Ph、  
 4-(Me)<sub>2</sub>N-Ph、  
 4-Me(MeC(O))N-Ph、  
 4-PhN(Me)-Ph、  
 4-PhCH<sub>2</sub>(MeC(O))N-Ph、  
 4-MeC(O)-Ph、  
 4-EtC(O)-Ph、  
 4-n-PrC(O)-Ph、  
 4-i-PrC(O)-Ph、  
 4-i-BuC(O)-Ph、  
 4-t-BuC(O)-Ph、  
 4-i-BuCH<sub>2</sub>C(O)-Ph、  
 4-Et(Me)<sub>2</sub>C(O)-Ph、  
 4-n-HexC(O)-Ph、  
 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-EtOCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-i-PrOCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-EtSCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-i-PrSCH<sub>2</sub>-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>C(O)-Ph、  
 4-CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>C(O)-Ph、  
 4-MeC(O)O-Ph、  
 4-EtC(O)O-Ph、  
 4-n-PrC(O)O-Ph、  
 4-i-PrC(O)O-Ph、  
 4-i-BuC(O)O-Ph、

(Cl<sub>2</sub>C=CHCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>)  
 -Ph,  
 4 - (BrC\*<sub>2</sub>CCH<sub>2</sub>S ) -Ph,  
 4 - (BrC\*<sub>2</sub>CCH<sub>2</sub>SO ) -Ph,  
 4 - (BrC\*<sub>2</sub>CCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub> ) -Ph,  
 4 -CHO-Ph,  
 4 -NO<sub>2</sub>-Ph,  
 3 -CN-Ph,  
 4 -CN-Ph,  
 4 - (Me )<sub>2</sub>N- Ph,  
 MeC ( O ) N- Ph, 4 -Me  
 4 -PhN (Me ) -Ph,  
 MeC ( O ) N- Ph, 4 -PhCH<sub>2</sub>  
 4 -MeC ( O ) -Ph,  
 4 -EtC ( O ) -Ph,  
 4 -n- PrC ( O ) -Ph,  
 4 -i- PrC ( O ) -Ph,  
 4 -i- BuC ( O ) -Ph,  
 4 -t-BuC ( O ) -Ph,  
 4 -i- BuCH<sub>2</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -Et (Me )<sub>2</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -n- HexC ( O ) -Ph,  
 4 -MeOCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -EtOCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -i- PrOCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -MeSCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -EtSCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -i- PrSCH<sub>2</sub>-Ph,  
 4 -CF<sub>3</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -MeC ( O ) O-Ph,  
 4 -EtC ( O ) O-Ph,  
 4 -n- PrC ( O ) O-Ph,  
 4 -i- PrC ( O ) O-Ph,  
 4 -i- BuC ( O ) O-Ph,



4-t-BuC(O)O-Ph、	4 -t-BuC ( O ) O-Ph,
4-i-BuCH <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -i- BuCH <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
4-Et(Me) <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -Et ( Me ) <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
4-n-HexC(O)O-Ph、	4 -n- HexC ( O ) O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> C(O)O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> C ( O ) O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -Ph,
3,4-F <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 -F <sub>2</sub> -Ph,
3,5-F <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -F <sub>2</sub> -Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -Ph,
2-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -CF <sub>3</sub> -Ph,
3-(3-Cl-Ph, CH <sub>2</sub> O)-Ph、	3 - ( 3 -Cl-Ph, CH <sub>2</sub> O ) -Ph,
2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-6-CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-6-Cl-Ph、	2 -F-6-Cl-Ph,
2-F-6-Me-Ph、	2 -F-6-Me-Ph,
2-F-6-MeO-Ph、	2 -F-6-MeO-Ph,
2-F-6-OH-Ph、	2 -F-6-OH-Ph,
2-F-6-MeS-Ph、	2 -F-6-MeS-Ph,
2-F-5-Cl-Ph、	2 -F-5-Cl-Ph,
2-F-5-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-5-CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-5-Me-Ph、	2 -F-5-Me-Ph,
2-F-5-MeO-Ph、	2 -F-5-MeO-Ph,
2-F-5-OH-Ph、	2 -F-5-OH-Ph,
2-F-5-MeS-Ph、	2 -F-5-MeS-Ph,
2-F-4-Cl-Ph、	2 -F-4- Cl-Ph,
2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-4- CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-4-Me-Ph、	2 -F-4- Me-Ph,
2-F-4-MeO-Ph、	2 -F-4- MeO-Ph,
2-F-3-Cl-Ph、	2 -F-3- Cl-Ph,
2-F-3-Me-Ph、	2 -F-3- Me-Ph,

2-F-3-MeO-Ph、	2 -F-3- MeO-Ph,
3-F-2-Cl-Ph、	3 -F-2- Cl-Ph,
3-F-2-Me-Ph、	3 -F-2- Me-Ph,
3-F-2-MeO-Ph、	3 -F-2- MeO-Ph,
3-F-4-Cl-Ph、	3 -F-4- Cl-Ph,
3-F-4-Me-Ph、	3 -F-4- Me-Ph,
3-F-4-MeO-Ph、	3 -F-4- MeO-Ph,
3-F-5-Cl-Ph、	3 -F-5-Cl-Ph,
3-F-5-Me-Ph、	3 -F-5-Me-Ph,
3-F-5-MeO-Ph、	3 -F-5-MeO-Ph,
3-F-6-Cl-Ph、	3 -F-6-Cl-Ph,
3-F-6-Me-Ph、	3 -F-6-Me-Ph,
3-F-6-MeO-Ph、	3 -F-6-MeO-Ph,
4-F-2-Cl-Ph、	4 -F-2- Cl-Ph,
4-F-2-Me-Ph、	4 -F-2- Me-Ph,
4-F-2-MeO-Ph、	4 -F-2- MeO-Ph,
4-F-3-Cl-Ph、	4 -F-3- Cl-Ph,
4-F-3-Me-Ph、	4 -F-3- Me-Ph,
4-F-3-MeO-Ph、	4 -F-3- MeO-Ph,
2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph、	2, 4 and 6 -F<sub>3</sub>-Ph,
2-OH-Ph、	2 -OH-Ph,
4-I-Ph、	4 -I-Ph,
4-MeOC(O)-Ph、	4 -MeOC (O ) -Ph,
4-MeNHC(O)-Ph、	4 -MeNHC (O ) -Ph,
2,6-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -Me<sub>2</sub>-Ph,
3-CF <sub>3</sub> -Ph、	3 -CF<sub>3</sub>-Ph,
2-Br-Ph、	2 -Br-Ph,
3-Br-Ph、	3 -Br-Ph,
2-MeC(O)-Ph、	2 -MeC (O ) -Ph,
2-I-Ph、	2 -I-Ph,
3-I-Ph、	3 -I-Ph,
4-c-Pr-Ph、	4 -c-Pr-Ph,
4-(2-Cl-c-Pr)-Ph、	4 - ( 2 -Cl-c-Pr ) -Ph,
4-(2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr)-Ph、	4 - ( 2 and 2 -Cl<sub>2</sub>-c-Pr ) -Ph,
4-(Ph-CH=CH)-Ph、	4 - (Ph-CH=CH ) -Ph,

4-(Ph-C≡C)-Ph、	4 - (Ph-C* C ) -Ph,
4-PhS-Ph、	4 -PhS-Ph,
4-HO-Ph、	4 -HO-Ph,
4-EtO-Ph、	4 -EtO-Ph,
4-PenO-Ph、	4 -PenO-Ph,
2-F-3-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-3- CF <sub>3</sub> -Ph,
2,3-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -Me <sub>2</sub> -Ph,
3,4-Me <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 -Me <sub>2</sub> -Ph,
3,5-Me <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -Me <sub>2</sub> -Ph, *
2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2-F-3-I-Ph、	2 -F-3- I-Ph,
2-F-4-I-Ph、	2 -F-4- I-Ph,
2-F-5-I-Ph、	2 -F-5-I-Ph,
2-F-6-I-Ph、	2 -F-6-I-Ph,
2-F-4-EtO-Ph、	2 -F-4- EtO-Ph,
2-F-4-PrO-Ph、	2 -F-4- PrO-Ph,
2-F-4-i-PrO-Ph、	2 -F-4- i- PrO-Ph,
2-F-4-BuO-Ph、	2 -F-4- BuO-Ph,
2-F-4-s-BuO-Ph、	2 -F-4- s-BuO-Ph,
2-F-4-i-BuO-Ph、	2 -F-4- i- BuO-Ph,
2-F-4-t-BuO-Ph、	2 -F-4- t-BuO-Ph,
2-F-4-PenO-Ph、	2 -F-4- PenO-Ph,
2-F-4-(2-Me-BuO)-Ph、	2 -F-4- (2 -Me-BuO ) -Ph,
2-F-4-(2,2-Me <sub>2</sub> -PrO)-Ph、	2 -F-4- (2 and 2 -Me <sub>2</sub> -PrO ) -Ph,
2-F-4-HexO-Ph、	2 -F-4- HexO-Ph,
2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph、	2 -F-4- (2 -Et-Hex ) O-Ph,
2-F-4-Et-Ph、	2 -F-4- Et-Ph,
2-F-4-Pr-Ph、	2 -F-4- Pr-Ph,
2-F-4-i-Pr-Ph、	2 -F-4- i- Pr-Ph,
2-F-4-Bu-Ph、	2 -F-4- Bu-Ph,
2-F-4-s-Bu-Ph、	2 -F-4- s-Bu-Ph,
2-F-4-i-Bu-Ph、	2 -F-4- i- Bu-Ph,

2-F-4-t-Bu-Ph、	2 -F-4- t-Bu-Ph,
2-F-4-Pen-Ph、	2 -F-4- Pen-Ph,
2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph、	2 -F-4- (2 -Me-Bu ) -Ph,
2-F-4-(2,2-Me <sub>2</sub> -Pr)-Ph、	2 -F-4- (2 and 2 -Me<sub>2</sub>-Pr ) -Ph,
2-F-4-Hex-Ph、	2 -F-4- Hex-Ph,
2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph、	2 -F-4- (2 -Et-Hex ) -Ph,
2-F-6-PhS-Ph、	2 -F-6-PhS-Ph,
2-F-6-Me <sub>2</sub> N-Ph、	2 -F-6-Me<sub>2</sub>-N- Ph,
2-F-6-MeNH-Ph、	2 -F-6-MeNH-Ph,
2-F-6-Ph-Ph、	2 -F-6-Ph-Ph,
3,4-methylenedioxy-Ph、	3 and 4 -methylenedioxy-Ph,
3,4-ethylenedioxy-Ph、	3 and 4 -ethylenedioxy-Ph,
2-F-3-Br-Ph、	2 -F-3- Br-Ph,
2-F-4-Br-Ph、	2 -F-4- Br-Ph,
2-F-5-Br-Ph、	2 -F-5-Br-Ph,
2-F-6-Br-Ph、	2 -F-6-Br-Ph,
3-F-2-Br-Ph、	3 -F-2- Br-Ph,
3-F-4-Br-Ph、	3 -F-4- Br-Ph,
3-F-5-Br-Ph、	3 -F-5-Br-Ph,
3-F-6-Br-Ph、	3 -F-6-Br-Ph,
4-F-2-Br-Ph、	4 -F-2- Br-Ph,
4-F-3-Br-Ph、	4 -F-3- Br-Ph,
2-Cl-3-Me-Ph、	2 -Cl-3- Me-Ph,
2-Cl-4-Me-Ph、	2 -Cl-4- Me-Ph,
2-Cl-5-Me-Ph、	2 -Cl-5-Me-Ph,
2-Cl-6-Me-Ph、	2 -Cl-6-Me-Ph,
3-Cl-2-Me-Ph、	3 -Cl-2- Me-Ph,
3-Cl-4-Me-Ph、	3 -Cl-4- Me-Ph,
3-Cl-5-Me-Ph、	3 -Cl-5-Me-Ph,
3-Cl-6-Me-Ph、	3 -Cl-6-Me-Ph,
4-Cl-2-Me-Ph、	4 -Cl-2- Me-Ph,
4-Cl-3-Me-Ph、	4 -Cl-3- Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 3 -F<sub>2</sub>-4- Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Me-Ph、	2 and 3 -F<sub>2</sub>-5-Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 3 -F<sub>2</sub>-6-Me-Ph,

2,4-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Me-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Me-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Me-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Me-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph,

2,4-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Br-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Pr-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-i-Pr-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-c-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-c-Pr-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-i-Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-s-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-s-Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-t-Bu-Ph 、 2,6-F <sub>2</sub> -4-Pen-Ph 、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-t-Bu-Ph, 2, 6-F <sub>2</sub> -4-Pen-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Hex-Ph 、 2,6-F <sub>2</sub> -4-Ph-Ph 、	2, 6-F <sub>2</sub> -4-Hex-Ph, 2,

2,6-F<sub>2</sub>-4-PhCH<sub>2</sub>-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-PrO-Ph 、  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-i-PrO-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-c-PrO-Ph 、  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-BuO-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-i-BuO-Ph 、  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-s-BuO-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-t-BuO-Ph 、  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-PenO-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-HexO-Ph 、  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-PhO-Ph 、 2,6-F<sub>2</sub>-4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph 、  
 2-F-6-Cl-3-MeO-Ph 、 2-F-6-Cl-4-MeO-Ph 、  
 2-F-6-Cl-5-MeO-Ph 、 2-F-6-Cl-3-Me-Ph 、  
 2-F-6-Cl-4-Me-Ph 、 2-F-6-Cl-5-Me-Ph 、  
 2-F-6-MeO-3-Cl-Ph 、 2-F-6-MeO-4-Cl-Ph 、  
 2-F-6-MeO-5-Cl-Ph 、 2-F-6-MeO-3-Me-Ph 、  
 2-F-6-MeO-4-Me-Ph 、 2-F-6-MeO-5-Me-Ph 、  
 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph 、 2-Cl-3-MeO-Ph 、  
 2-Cl-4-MeO-Ph 、 2-Cl-5-MeO-Ph 、  
 2-Cl-6-MeO-Ph 、 3-Cl-2-MeO-Ph 、  
 3-Cl-4-MeO-Ph 、 3-Cl-5-MeO-Ph 、  
 3-Cl-6-MeO-Ph 、 4-Cl-2-MeO-Ph 、  
 4-Cl-3-MeO-Ph 、 2-Me-3-MeO-Ph 、  
 2-Me-4-MeO-Ph 、 2-Me-5-MeO-Ph 、  
 2-Me-6-MeO-Ph 、 3-Me-2-MeO-Ph 、  
 3-Me-4-MeO-Ph 、 3-Me-5-MeO-Ph 、  
 3-Me-6-MeO-Ph 、 4-Me-3-MeO-Ph および  
 2,6-(MeO)<sub>2</sub>-Ph 等があげられる。

## 【0077】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルスルホニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルカルボニルで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルとしては、5-クロロチオフェン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび 1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

## 【0078】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>3</sup> および X<sup>4</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカル

6-F<sub>2</sub>-4-Ph-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-PrO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-i-PrO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-c-PrO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-BuO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-i-BuO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-s-BuO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-t-BuO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-PenO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-HexO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-PhO-Ph, 2, 6-F<sub>2</sub>-4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph, 2, 2-F-6-Cl-3-MeO-Ph, 2, 2-F-6-Cl-4-MeO-Ph, 2, 2-F-6-Cl-5-MeO-Ph, 2, 2-F-6-Cl-3-Me-Ph, 2, 2-F-6-Cl-4-Me-Ph, 2, 2-F-6-Cl-5-Me-Ph, 2, 2-F-6-MeO-3-Cl-Ph, 2, 2-F-6-MeO-4-Cl-Ph, 2, 2-F-6-MeO-5-Cl-Ph, 2, 2-F-6-MeO-3-Me-Ph, 2, 2-F-6-MeO-4-Me-Ph, 2, 2-F-6-MeO-5-Me-Ph, 2, 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph, 2, 2-Cl-3-MeO-Ph, 2, 2-Cl-4-MeO-Ph, 2, 2-Cl-5-MeO-Ph, 2, 2-Cl-6-MeO-Ph, 2, 3-Cl-2-MeO-Ph, 2, 3-Cl-4-MeO-Ph, 2, 3-Cl-5-MeO-Ph, 2, 3-Cl-6-MeO-Ph, 2, 4-Cl-2-MeO-Ph, 2, 4-Cl-3-MeO-Ph, 2, 2-Me-3-MeO-Ph, 2, 2-Me-4-MeO-Ph, 2, 2-Me-5-MeO-Ph, 2, 2-Me-6-MeO-Ph, 2, 3-Me-2-MeO-Ph, 2, 3-Me-4-MeO-Ph, 2, 3-Me-5-MeO-Ph, 2, 3-Me-6-MeO-Ph, 2, 4-Me-3-MeO-Ph and 2 and 6 - you can list (MeO) etc.

## 【0077】

In R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> and R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl, R<sup>a</sup> with the optionally substitutable heteroaryl sulfonyl, R<sup>a</sup> it is defined with optionally substitutable heteroaryl carbonyl, you can list 5-chloro thiophene-2-yl, 3,5-dimethyl furan-2-yl, 3-cyanopyrrole-1-yl, oxazole-2-yl, 2-methyl sulfonyl oxazole-4-yl, 4-methyl thiazole-2-yl, 2-trifluoromethyl imidazole-1-yl, isoxazole-3-yl, 3-chloro isoxazole-4-yl, 3-methyl isothiazole-5-yl, 3-phenylpyrazole-1-yl, 1-methyl pyrazole-5-yl, 2-methyl sulfonyl-1, 3, 4-oxadiazole-5-yl, 2-bromo-1, 3, 4-thiadiazole-2-yl, 1, 2, 4-oxadiazole-3-yl, 1, 2, 4-thiadiazole-5-yl, 1, 2, 4-triazole-1-yl, 1, 2, 3-thiadiazole-5-yl, 1, 2, 3-triazole-1-yl, 1, 2, 3, 4-tetrazole-1-yl, 6-phenoxy pyridine-2-yl, 6-methoxy pyrimidine-2-yl, pyrazine-2-yl, pyridazine-3-yl, 1, 3, 5-triazine-2-yl and 1, 2 and 4-triazine-6-yl etc with R<sup>a</sup> as optionally substitutable heteroaryl.

## 【0078】

In R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup>, X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup> and X<sup>4</sup> with R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl, R<sup>a</sup> with the optionally substitutable heteroaryl sulfonyl, R<sup>a</sup> it is defined with optionally substitutable heteroaryl carbonyl, you can list 5-chloro thiophene-2-yl, 3,5-dimethyl furan-2-yl, 3-cyanopyrrole-1-yl, oxazole-2-yl, 2-methyl sulfonyl oxazole-4-yl, 4-methyl thiazole-2-yl, 2-trifluoromethyl imidazole-1-yl, isoxazole-3-yl, 3-chloro isoxazole-4-yl, 3-methyl isothiazole-5-yl, 3-phenylpyrazole-1-yl, 1-methyl pyrazole-5-yl, 2-methyl sulfonyl-1, 3, 4-oxadiazole-5-yl, 2-bromo-1, 3, 4-thiadiazole-2-yl, 1, 2, 4-oxadiazole-3-yl, 1, 2, 4-thiadiazole-5-yl, 1, 2, 4-triazole-1-yl, 1, 2, 3-thiadiazole-5-yl, 1, 2, 3-triazole-1-yl, 1, 2, 3, 4-tetrazole-1-yl, 6-phenoxy pyridine-2-yl, 6-methoxy pyrimidine-2-yl, pyrazine-2-yl, pyridazine-3-yl, 1, 3, 5-triazine-2-yl and 1, 2 and 4-triazine-6-yl etc with R<sup>a</sup> as optionally substitutable heteroaryl.

ボニルで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび 4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

【0079】

R<sup>5</sup>、

R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、ベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-*t*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロ

with optionally substitutable phenyl sulfonyl and the R<sup><sup>a</sup></sup> it is defined with optionally substitutable phenyl carbonyl, you can list phenyl, 2- fluorophenyl, 3- fluorophenyl, 4- fluorophenyl, 2- chlorophenyl, 3- chlorophenyl, 4- chlorophenyl, 2- bromophenyl, 3- bromophenyl, 4- bromophenyl, 4- iodo phenyl, 2, 4- dichlorophenyl, 3, 4- dichlorophenyl, 2, 6-difluoro phenyl, 2, 6-dichlorophenyl, 2- fluoro -4- chlorophenyl, 2, 3, 4, 5, 6-pentafluorophenyl, 2- methylphenyl, 3- methylphenyl, 4- methylphenyl, 2, 5-dimethylphenyl, 4- methyl -2, 3, 5, 6-tetrafluorophenyl, 2- methoxyphenyl, 3- methoxyphenyl, 4- methoxyphenyl, 2, 6-dimethoxy phenyl, 3, 4- dimethoxy phenyl, 3, 4, 5-trimethoxy phenyl, 2- trifluoromethyl phenyl, 3- trifluoromethyl phenyl and 4-trifluoromethyl phenyl etc with R<sup><sup>a</sup></sup> as optionally substitutable phenyl .

【0079】

R<sup><sup>5</sup></sup>,

In R<sup><sup>6</sup></sup>, R<sup><sup>7</sup></sup>, R<sup><sup>b</sup></sup> and R<sup><sup>c</sup></sup>, with R<sup><sup>a</sup></sup> with optionally substitutable phenyl C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl sulfonyl and the R<sup><sup>a</sup></sup> it is defined with optionally substitutable phenyl C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl carbonyl, benzyl, 2- chloro benzyl, 3- bromo benzyl, 4- chloro benzyl, 4- methylbenzyl, 4- *t*-butyl benzyl, 2- methylbenzyl, 2- methoxy benzyl, 1- phenylethyl, 1- (3 -chlorophenyl ) ethyl, 2- phenylethyl, 1- methyl -1- phenylethyl, 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl, 1- (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl, 1- phenyl propyl, 2- phenyl propyl, 3- phenyl propyl, 1- phenyl butyl, 2- phenyl butyl, 3- phenyl butyl, 4- phenyl butyl, 1- methyl -1- phenyl propyl, 1- methyl -2- phenyl propyl, 1- methyl -3- phenyl propyl, 2- methyl -2- phenyl propyl, 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl, 1- phenyl pentyl, 2- phenyl pentyl, 3- phenyl pentyl, 4- phenyl pentyl, 5-phenyl pentyl, 1- methyl -1- phenyl butyl, 1- methyl -2- phenyl butyl, 1- methyl -3- phenyl butyl, 1- methyl -4- phenyl butyl, 2- methyl -2- phenyl butyl, 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl, 1- phenyl hexyl, 2- phenyl hexyl, 3- phenyl hexyl, 4- phenyl hexyl, 5-phenyl hexyl, 6-phenyl hexyl, 1- methyl -1- phenyl pentyl, 1- methyl -2- phenyl pentyl, 1- methyl -3- phenyl pentyl, 1- methyl -4- phenyl pentyl, 2- methyl -2- phenyl pentyl, 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyl and 2 -methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyl etc with R<sup><sup>a</sup></sup> as optionally substitutable phenyl C<sub><sub>1</sub></sub>~C<sub><sub>6</sub></sub>alkyl .



エニル)-2-メチルペンチルおよび 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

[0080]

$R^7$ ,  $R^b$ ,  $R^c$ ,  $X^1$ ,  $X^3$  および  $X^4$  における、 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシおよび  $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシカルボニルにより定義される、 $R^a$  で置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロフェノキシ、2-ブロモフェノキシ、3-ブロモフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび 4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

[0081]

$R^7$ 、

$R^b$  および  $R^c$  の定義における、

$R^a$  で置換されていてもよいフェニル  $C_1$ - $C_6$  アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-*t*-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-

[0080]

In  $R^{<sup>7</sup>}$ ,  $R^{<sup>b</sup>}$ ,  $R^{<sup>c</sup>}$ ,  $X^{<sup>1</sup>}$ ,  $X^{<sup>3</sup>}$  and  $X^{<sup>4</sup>}$ , with  $R^{<sup>a</sup>}$  it is defined with the optionally substitutable phenoxy and  $R^{<sup>a</sup>}$  by optionally substitutable phenoxy carbonyl, you can list phenoxy, 2- fluorophenoxy, 3- fluorophenoxy, 4- fluorophenoxy, 2- chlorophenoxy, 3- chlorophenoxy, 4- chlorophenoxy, 2- bromo phenoxy, 3- bromo phenoxy, 4- bromo phenoxy, 4- iodo phenoxy, 2, 4- dichloro phenoxy, 3, 4- dichloro phenoxy, 2, 6- difluoro phenoxy, 2, 6- dichloro phenoxy, 2- fluoro -4- chlorophenoxy, 2, 3, 4, 5, 6- penta fluorophenoxy, 2- methyl phenoxy, 3- methyl phenoxy, 4- methyl phenoxy, 2, 5- dimethyl phenoxy, 4- methyl -2, 3, 5, 6- tetrafluoro phenoxy, 2- methoxy phenoxy, 3- methoxy phenoxy, 4- methoxy phenoxy, 2, 6- dimethoxy phenoxy, 3, 4- dimethoxy phenoxy, 3, 4, 5- trimethoxy phenoxy, 2- trifluoromethyl phenoxy, 3- trifluoromethyl phenoxy and 4- trifluoromethyl phenoxy etc with  $R^{<sup>a</sup>}$  as optionally substitutable phenoxy.

[0081]

$R^{<sup>7</sup>}$ ,

In defining  $R^{<sup>b</sup>}$  and  $R^{<sup>c</sup>}$ ,

As optionally substitutable phenyl  $C^{<sub>1</sub>-C^{<sub>6</sub>}$  alkoxy with  $R^{<sup>a</sup>}$ , benzyloxy, 2- chloro benzyloxy, 3- bromo benzyloxy, 4- chloro benzyloxy, 4- methylbenzyl oxy, 4- *t*-butyl benzyloxy, 2- methylbenzyl oxy, 2- methoxy benzyloxy, 1- phenylethyl oxy, 1- (3- chlorophenyl) ethyl oxy, 2- phenylethyl oxy, 1- methyl -1- phenylethyl oxy, 1- (4- chlorophenyl) - 1- methylethyl oxy, 1- (3- chlorophenyl) - 1- methylethyl oxy, 1- phenyl propyl oxy, 2- phenyl propyl oxy, 3- phenyl propyl oxy, 1- phenyl butyl oxy, 2- phenyl butyl oxy, 3- phenyl butyl oxy, 4- phenyl butyl oxy, 1- methyl -1- phenyl propyl oxy, 1- methyl -2- phenyl propyl oxy, 1- methyl -3- phenyl propyl oxy, 2- methyl -2- phenyl propyl oxy, 2- (4- chlorophenyl) - 2- methyl -propyl oxy, 2- methyl -2- (3- methylphenyl) propyl oxy, 1- phenyl pentyloxy, 2- phenyl pentyloxy, 3- phenyl pentyloxy, 4- phenyl pentyloxy, 5- phenyl pentyloxy, 1- methyl -1- phenyl butyl oxy, 1- methyl -2- phenyl butyl oxy, 1- methyl -3- phenyl butyl oxy, 1- methyl -4- phenyl butyl oxy, 2- methyl -2- phenyl butyl oxy, 2- (4- chlorophenyl) - 2- methyl butyl oxy, 2- methyl -2- (3- methylphenyl) butyl oxy, 1- phenyl hexyloxy, 2- phenyl hexyloxy, 3- phenyl hexyloxy, 4- phenyl hexyloxy, 5- phenyl hexyloxy, 6- phenyl hexyloxy, 1-

メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

## 【0082】

R<sup>7</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリールオキシとしては、5-クロロチオフェン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-ピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3-トリアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび 1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

## 【0083】

R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフィニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロ

methyl -1- phenyl pentyloxy , 1- methyl -2- phenyl pentyloxy , 1- methyl -3- phenyl pentyloxy , 1- methyl -4- phenyl pentyloxy , 2- methyl -2- phenyl pentyloxy , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2-methyl pentyloxy and 2 -methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyloxy etc as phenyl alkoxy of the straight chain or branched .

## 【0082】

In R<sup><sup>7</sup></sup>, R<sup><sup>b</sup></sup> and R<sup><sup>c</sup></sup>, with R<sup><sup>a</sup></sup> with optionally substitutable heteroaryloxy and the R<sup><sup>a</sup></sup> it is defined with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl , you can list 5 -chloro thiophene -2- yloxy , 3, 5-dimethyl furan -2- yloxy , 3- cyano -pyrrole -1- yloxy , oxazole -2- yloxy , 2- methyl sulfenyl oxazole -4- yloxy , 4- methyl thiazole -2- yloxy , 2- trifluoromethyl imidazole -4- yloxy , isoxazole -3- yloxy , 3- chloro isoxazole -4- yloxy , 3- methyl isothiazole -5-yloxy , 1- benzyl -3- phenylpyrazole -5-yloxy , 1- methyl pyrazole -5-yloxy , 2- methyl sulfonyl -1, 3, 4- oxadiazole -5-yloxy , 2- bromo -1, 3, 4- thiadiazole -2- yloxy , 1, 2, 4- oxadiazole -3- yloxy , 1, 2, 4- thiadiazole -5-yloxy , 1, 2, 4- triazole -3- yloxy , 1, 2, 3- thiadiazole -5-yloxy , 1, 2, 3- triazole -5-yloxy , 1, 2, 3, 4- tetrazole -5-yloxy , 6-phenoxy pyridine -2- yloxy , 6-methoxy pyrimidine -2- yloxy , pyrazine -2- yloxy , pyridazine -3- yloxy , 1, 3, 5-triazine -2- yloxy and 1, 2 and 4 -triazine -6-yloxy etc with R<sup><sup>a</sup></sup> as optionally substitutable heteroaryloxy .

## 【0083】

In R<sup><sup>c</sup></sup>, with R<sup><sup>a</sup></sup> with optionally substitutable phenyl sulfenyl , R<sup><sup>a</sup></sup> with optionally substitutable phenyl sulfinyl and the R<sup><sup>a</sup></sup> it is defined with optionally substitutable phenyl carbonyl oxy , you can list phenyl , 2- fluorophenyl , 3- fluorophenyl , 4- fluorophenyl , 2- chlorophenyl , 3- chlorophenyl , 4- chlorophenyl , 2- bromophenyl , 3- bromophenyl , 4-

フェニル、4-クロロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

[0084]

R<sup>c</sup>における、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシで定義される R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-*t*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル

bromophenyl, 4- iodo phenyl, 2, 4- dichlorophenyl, 3, 4- dichlorophenyl, 2, 6-difluoro phenyl, 2, 6-dichlorophenyl, 2- fluoro -4- chlorophenyl, 2, 3, 4, 5, 6-pentafluorophenyl, 2- methylphenyl, 3- methylphenyl, 4- methylphenyl, 2, 5-dimethylphenyl, 4- methyl -2, 3, 5, 6-tetrafluorophenyl, 2- methoxyphenyl, 3- methoxyphenyl, 4- methoxyphenyl, 2, 6-dimethoxy phenyl, 3, 4- dimethoxy phenyl, 3, 4, 5-trimethoxy phenyl, 2- trifluoromethyl phenyl, 3- trifluoromethyl phenyl and 4-trifluoromethyl phenyl etc with R<sup>c</sup> as optionally substitutable phenyl .

[0084]

In R<sup>c</sup> as,

With R<sup>a</sup> as optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl,

As optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl with R<sup>a</sup> as optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl and R<sup>a</sup> is defined with optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy, benzyl, 2- chloro benzyl, 3- bromo benzyl, 4- chloro benzyl, 4- methylbenzyl, 4- *t*-butyl benzyl, 2- methylbenzyl, 2- methoxy benzyl, 1- phenylethyl, 1- (3- chlorophenyl ) ethyl, 2- phenylethyl, 1- methyl -1- phenylethyl, 1- (4- chlorophenyl ) - 1 -methylethyl, 1- (3- chlorophenyl ) - 1 -methylethyl, 1- phenyl propyl, 2- phenyl propyl, 3- phenyl propyl, 1- phenyl butyl, 2- phenyl butyl, 3- phenyl butyl, 4- phenyl butyl, 1- methyl -1- phenyl propyl, 1- methyl -2- phenyl propyl, 1- methyl -3- phenyl propyl, 2- methyl -2- phenyl propyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl, 1- phenyl pentyl, 2- phenyl pentyl, 3- phenyl pentyl, 4- phenyl pentyl, 5-phenyl pentyl, 1- methyl -1- phenyl butyl, 1- methyl -2- phenyl butyl, 1- methyl -3- phenyl butyl, 1- methyl -4- phenyl butyl, 2- methyl -2- phenyl butyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl, 1- phenyl hexyl, 2- phenyl hexyl, 3- phenyl hexyl, 4- phenyl hexyl, 5-phenyl hexyl, 6-phenyl hexyl, 1- methyl -1- phenyl pentyl, 1- methyl -2- phenyl pentyl, 1- methyl -3- phenyl pentyl, 1- methyl -4- phenyl pentyl, 2- methyl -2- phenyl pentyl, 2- (4- chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyl and 2- methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyl etc as phenyl alkyl of straight chain or branched .

および 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

【0085】

R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルスルフィニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルスルフェニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルカルボニルオキシで定義される R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアルとしては、5-クロロチオフェン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブromo-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび 1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

【0086】

R<sup>c</sup> の定義における R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリアルアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキシルオキシ等が挙げられる。

【0087】

R<sup>c</sup> における、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシで定義される、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリアル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリアルアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロ

【0085】

In R<sup>c</sup>, you can list 5-chloro thiophene -2- yl, 3, 5-dimethyl furan -2- yl, 3- cyanopyrrole -1- yl, oxazole -2- yl, 2- methyl sulfenyl oxazole -4- yl, 4- methyl thiazole -2- yl, 2- trifluoromethyl imidazole -1- yl, isoxazole -3- yl, 3- chloro isoxazole -4- yl, 3- methyl isothiazole -5-yl, 3- phenylpyrazole -1- yl, 1- methyl pyrazole -5-yl, 2- methyl sulfonyl -1, 3, 4- oxadiazole -5-yl, 2- bromo -1, 3, 4- thiadiazole -2- yl, 1, 2, 4- oxadiazole -3- yl, 1, 2, 4- thiadiazole -5-yl, 1, 2, 4- triazole -1- yl, 1, 2, 3- thiadiazole -5-yl, 1, 2, 3- triazole -1- yl, 1, 2, 3, 4- tetrazole -1- yl, 6-phenoxy pyridine -2- yl, 6-methoxy pyrimidine -2- yl, pyrazine -2- yl, pyridazine -3- yl, 1, 3, 5-triazine -2- yl and 1, 2 and 4 -triazine -6-yl etc with the R<sup>a</sup> which with R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfinyl, R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl sulfenyl and R<sup>a</sup> is defined with optionally substitutable heteroaryl carbonyl oxy as optionally substitutable heteroaryl .

【0086】

As optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy with R<sup>a</sup> in defining R<sup>c</sup>, you can list the pyridine -2- yl methyl oxy, 5-chloro thiophene -2- yl methyl oxy, 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl oxy, 2- (3- methyl furan -2- yl ) ethyl oxy, 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl oxy, 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl oxy, 5- (triazole -1- yl ) pentyloxy and 6 - (pyrrole -1- yl ) hexyloxy etc as heteroaryl alkoxy of straight chain or branched .

【0087】

You can list pyridine -2- yl methyl, 5-chloro thiophene -2- yl methyl, 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl, 2- (3- methyl furan -2- yl ) ethyl, 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl, 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl, 5- (triazole -1- yl ) pentyl and 6 - the(pyrrole -1- yl ) hexyl etc as heteroaryl alkyl of straight chain or branched as optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl with R<sup>a</sup>, in R<sup>c</sup>, with R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl, R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl

ピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

【0088】

Y' における、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルスルホニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義される R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニルとしては、

Ph、

2-Cl-Ph、

3-Cl-Ph、

4-Cl-Ph、

2-F-Ph、

3-F-Ph、

4-F-Ph、

2-Me-Ph、

3-Me-Ph、

4-Me-Ph、

2-MeO-Ph、

3-MeO-Ph、

4-MeO-Ph、

4-Br-Ph、

2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph、

3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph、

2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph、

3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph、

2-Cl-4-Me-Ph、

2-MeO-4-Me-Ph、

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,  
R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,  
R<sup>a</sup> it is defined with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy .

[0088]

In Y\*,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfinyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfinyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl sulfonyl ,

With R<sup>c</sup> which with R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenyl carbonyl and R<sup>c</sup> is defined with optionally substitutable phenyl carbonyl oxy as optionally substitutable phenyl ,

Ph,

2-Cl-Ph,

3-Cl-Ph,

4-Cl-Ph,

2-F-Ph,

3-F-Ph,

4-F-Ph,

2-Me-Ph,

3-Me-Ph,

4-Me-Ph,

2-MeO-Ph,

3-MeO-Ph,

4-MeO-Ph,

4-Br-Ph,

2 and 4 -Cl<sub>2</sub>-Ph,

3 and 4 -Cl<sub>2</sub>-Ph,

2, 4 and 6 -Cl<sub>3</sub>-Ph,

3 and 4 - (MeO)<sub>2</sub>-Ph,

2-Cl-4-Me-Ph,

2-MeO-4-Me-Ph,

2-Cl-4-i-PrO-Ph、	2 -Cl-4- i- PrO-Ph,
3-Cl-4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph、	3 -Cl-4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph,
2,4-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 -Me <sub>2</sub> -Ph,
2,5-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -Me <sub>2</sub> -Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -Ph,
2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph、	2, 3, 4, 5 and 6 -F <sub>5</sub> -Ph,
4-Et-Ph、	4 -Et-Ph,
4-i-Pr-Ph、	4 -i- Pr-Ph,
4-n-Bu-Ph、	4 -n- Bu-Ph,
4-s-Bu-Ph、	4 -s-Bu-Ph,
4-t-Bu-Ph、	4 -t-Bu-Ph,
4-(t-BuCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (t-BuCH <sub>2</sub> ) -Ph,
4-Et(Me) <sub>2</sub> -Ph、	4 -Et (Me ) <sub>2</sub> -Ph,
4-n-Hex-Ph、	4 -n- Hex-Ph,
4-((Me) <sub>2</sub> (CN)C)-Ph、	4 - (Me ) <sub>2</sub> (CN ) C -Ph,
4-PhCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -PhCH <sub>2</sub> -Ph,
4-(4-F-Ph)(Me) <sub>2</sub> -Ph、	4 - (4 -F-Ph ) (Me ) <sub>2</sub> -Ph,
4-(MeCH=CH)-Ph、	4 - (MeCH=CH ) -Ph,
4-(MeC≡C)-Ph、	4 - (MeC≡C ) -Ph,
4-CF <sub>3</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> -Ph,
4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph,
4-(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> ) -Ph,
4-(BrC≡C)-Ph、	4 - (BrC≡C ) -Ph,
4-(2,2-F <sub>2</sub> -c-BuCH <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (2 and 2 -F <sub>2</sub> -c-BuCH <sub>2</sub> ) -Ph,
4-(1-Me-c-Pr)-Ph、	4 - (1 -Me-c-Pr ) -Ph,
4-i-PrO-Ph、	4 -i- PrO-Ph,
4-t-BuO-Ph、	4 -t-BuO-Ph,
4-n-HexO-Ph、	4 -n- HexO-Ph,
4-MeCC(O)Ph、	4 -MeCC (O ) Ph ,
4-(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O)-Ph、	4 - (CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O) -Ph,
4-CHF <sub>2</sub> O-Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> O-Ph,
4-CBrF <sub>2</sub> O-Ph、	4 -CBrF <sub>2</sub> O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph,
4-(CF <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O)-Ph、	4 - (CF <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O) -Ph,

4-CCl <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub> O-Ph、	-Ph,
4-MeS-Ph、	4 -CCl <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub> O-Ph,
4-s-BuS-Ph、	4 -MeS-Ph,
4-EtSO-Ph、	4 -s-BuS-Ph,
4-MeSO <sub>2</sub> -Ph、	4 -EtSO-Ph,
4-EtSO <sub>2</sub> -Ph、	4 -MeSO <sub>2</sub> -Ph,
4-i-PrSO <sub>2</sub> -Ph、	4 -EtSO <sub>2</sub> -Ph,
4-t-BuSO <sub>2</sub> -Ph、	4 -i- PrSO <sub>2</sub> -Ph,
4-(MeCH=CHCH <sub>2</sub> S)-Ph、	4 -t-BuSO <sub>2</sub> -Ph,
4-(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> SO)-Ph、	4 - (MeCH=CHCH <sub>2</sub> S ) -Ph,
4-(ClCH=CHCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> SO ) -Ph,
4-(HC≡CCH <sub>2</sub> S)-Ph、	4 - (ClCH=CHCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> ) -Ph,
4-(HC≡CCH <sub>2</sub> SO)-Ph、	4 - (HC *CCH <sub>2</sub> S ) -Ph,
4-(HC≡CCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (HC *CCH <sub>2</sub> SO-Ph )
4-CHF <sub>2</sub> S-Ph、	4 - (HC *CCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> ) -Ph,
4-CBrF <sub>2</sub> S-Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> S-Ph,
4-CF <sub>3</sub> S-Ph、	4 -CBrF <sub>2</sub> S-Ph,
4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> S-Ph,
4-CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> S-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S-Ph,
4-CHF <sub>2</sub> SO-Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> S-Ph,
4-CBrF <sub>2</sub> SO-Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> SO-Ph,
4-CF <sub>3</sub> SO-Ph、	4 -CBrF <sub>2</sub> SO-Ph,
4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> SO-Ph,
4-CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph,
4-CHF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph,
4-CBrF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph、	4 -CHF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph,
4-CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> -Ph、	4 -CBrF <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -Ph,
4-(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> S)-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> -Ph,
4-(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> SO)-Ph、	4 - (Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> S ) -Ph,
4-(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> SO ) -Ph,
	4 -
4-(BrC≡CCH <sub>2</sub> S)-Ph、	(Cl <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> ) -Ph,
4-(BrC≡CCH <sub>2</sub> SO)-Ph、	4 - (BrC*CCH <sub>2</sub> S ) -Ph,
4-(BrC≡CCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> )-Ph、	4 - (BrC*CCH <sub>2</sub> SO ) -Ph,
	4 - (BrC*CCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> ) -Ph,

4-CHO-Ph、  
 4-NO<sub>2</sub>-Ph、  
 3-CN-Ph、  
 4-CN-Ph、  
 4-(Me)<sub>2</sub>N-Ph、  
 4-Me(MeC(O))N-Ph、  
 4-PhMeN-Ph、  
 4-PhCH<sub>2</sub>(MeC(O))N-Ph、  
 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(2-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(3-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(4-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(2-Me-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(3-Me-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(4-F-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(4-Et-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(2-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-(3-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-(4-Cl-Ph)CH<sub>2</sub>SO-Ph、  
 4-(2-Me-Ph)CH<sub>2</sub>S-Ph、  
 4-(3-Me-Ph)CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph、  
 4-(2,4-F<sub>2</sub>-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 3-(3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(2,5-Me<sub>2</sub>-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-(2,3,5,6-F<sub>5</sub>-Ph)CH<sub>2</sub>O-Ph、  
 4-MeC(O)-Ph、  
 4-EtC(O)-Ph、  
 4-n-PrC(O)-Ph、  
 4-i-PrC(O)-Ph、  
 4-i-BuC(O)-Ph、  
 4-t-BuC(O)-Ph、  
 4-i-BuCH<sub>2</sub>C(O)-Ph、  
 4-Et(Me)<sub>2</sub>C(O)-Ph、  
 4-n-HexC(O)-Ph、

4 -CHO-Ph,  
 4 -NO<sub>2</sub>-Ph,  
 3 -CN-Ph,  
 4 -CN-Ph,  
 4 - (Me ) <sub>2</sub>N- Ph,  
 MeC ( O ) N- Ph, 4 -Me  
 4 -PhMeN-Ph,  
 MeC ( O ) N- Ph, 4 -PhCH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 -PhCH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 2 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 3 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 4 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 2 -Me-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 3 -Me-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 4 -F-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 4 -Et-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 2 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>S-Ph,  
 4 - ( 3 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>S-Ph,  
 4 - ( 4 -Cl-Ph ) CH<sub>2</sub>SO-Ph,  
 4 - ( 2 -Me-Ph ) CH<sub>2</sub>S-Ph,  
 4 - ( 3 -Me-Ph ) CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-Ph,  
 4 - ( 2 and 4 -F<sub>2</sub>-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 3 - ( 3 and 4 -Cl<sub>2</sub>-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 2 and 5 -Me<sub>2</sub>-Ph ) CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 - ( 2, 3, 5 and 6 -F<sub>5</sub>-Ph )  
 CH<sub>2</sub>O-Ph,  
 4 -MeC ( O ) -Ph,  
 4 -EtC ( O ) -Ph,  
 4 -n- PrC ( O ) -Ph,  
 4 -i- PrC ( O ) -Ph,  
 4 -i- BuC ( O ) -Ph,  
 4 -t-BuC ( O ) -Ph,  
 4 -i- BuCH<sub>2</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -Et ( Me ) <sub>2</sub>C ( O ) -Ph,  
 4 -n- HexC ( O ) -Ph,



4-PhC(O)-Ph、	4 -PhC ( O ) -Ph,
4-(2-Cl-Ph)C(O)-Ph、	4 - ( 2 -Cl-Ph ) C ( O ) -Ph,
4-(3-Br-Ph)C(O)-Ph、	4 - ( 3 -Br-Ph ) C ( O ) -Ph,
4-(4-Cl-Ph)C(O)-Ph、	4 - ( 4 -Cl-Ph ) C ( O ) -Ph,
4-(2-Me-Ph)C(O)-Ph、	4 - ( 2 -Me-Ph ) C ( O ) -Ph,
4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -MeOCH <sub>2</sub> -Ph,
4-EtOCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -EtOCH <sub>2</sub> -Ph,
4-i-PrOCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -i- PrOCH <sub>2</sub> -Ph,
4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -MeSCH <sub>2</sub> -Ph,
4-EtSCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -EtSCH <sub>2</sub> -Ph,
4-i-PrSCH <sub>2</sub> -Ph、	4 -i- PrSCH <sub>2</sub> -Ph,
4-CF <sub>3</sub> C(O)-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> C ( O ) -Ph,
4-CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C(O)-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C ( O ) -Ph,
4-MeC(O)O-Ph、	4 -MeC ( O ) O-Ph,
4-EtC(O)O-Ph、	4 -EtC ( O ) O-Ph,
4-n-PrC(O)O-Ph、	4 -n- PrC ( O ) O-Ph,
4-i-PrC(O)O-Ph、	4 -i- PrC ( O ) O-Ph,
4-i-BuC(O)O-Ph、	4 -i- BuC ( O ) O-Ph,
4-t-BuC(O)O-Ph、	4 -t-BuC ( O ) O-Ph,
4-i-BuCH <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -i- BuCH <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
4-Et(Me) <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -Et ( Me ) <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
4-n-HexC(O)O-Ph、	4 -n- HexC ( O ) O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> C(O)O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> C ( O ) O-Ph,
4-CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C(O)O-Ph、	4 -CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> C ( O ) O-Ph,
4-PhC(O)O-Ph、	4 -PhC ( O ) O-Ph,
3-Ph-Ph、	3 -Ph-Ph,
4-Ph-Ph、	4 -Ph-Ph,
4-(4-Cl-Ph)-Ph、	4 - ( 4 -Cl-Ph ) -Ph,
4-(2,5-Me <sub>2</sub> -Ph)-3-Me-Ph、	4 - ( 2 and 5 -Me <sub>2</sub> -Ph ) - 3 -Me-Ph,
3-PhO-Ph、	3 -PhO-Ph,
4-PhO-Ph、	4 -PhO-Ph,
4-(4-Cl-Ph)O-Ph、	4 - ( 4 -Cl-Ph ) O-Ph,
4-(4-Me-Ph)O-Ph、	4 - ( 4 -Me-Ph ) O-Ph,
4-(4-F-Ph)O-Ph、	4 - ( 4 -F-Ph ) O-Ph,
4-(4-MeO-Ph)O-Ph、	4 - ( 4 -MeO-Ph ) O-Ph,

4-(2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph)O-Ph、	4 - (2 and 4 -Cl <sub>2</sub> -Ph ) O-Ph,
4-(3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph)O-Ph、	4 - (3 and 4 -Cl <sub>2</sub> -Ph ) O-Ph,
4-(2-Pyridyl)-Ph、	4 - (2 -Pyridyl ) -Ph,
4-(5-Cl-2-Pyridyl)-Ph、	4 - (5 -Cl-2- Pyridyl ) -Ph,
2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -Cl <sub>2</sub> -Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -Ph,
3,4-F <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 -F <sub>2</sub> -Ph,
3,5-F <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -F <sub>2</sub> -Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -Ph,
2-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -CF <sub>3</sub> -Ph,
3-(3-Cl-PhCH <sub>2</sub> O)-Ph、	3 - (3 -Cl-PhCH <sub>2</sub> O ) -Ph,
2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-6-CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-6-Cl-Ph、	2 -F-6-Cl-Ph,
2-F-6-Me-Ph、	2 -F-6-Me-Ph,
2-F-6-MeO-Ph、	2 -F-6-MeO-Ph,
2-F-6-OH-Ph、	2 -F-6-OH-Ph,
2-F-6-MeS-Ph、	2 -F-6-MeS-Ph,
2-F-5-Cl-Ph、	2 -F-5-Cl-Ph,
2-F-5-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-5-CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-5-Me-Ph、	2 -F-5-Me-Ph,
2-F-5-MeO-Ph、	2 -F-5-MeO-Ph,
2-F-5-OH-Ph、	2 -F-5-OH-Ph,
2-F-5-MeS-Ph、	2 -F-5-MeS-Ph,
2-F-4-Cl-Ph、	2 -F-4- Cl-Ph,
2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-4- CF <sub>3</sub> -Ph,
2-F-4-Me-Ph、	2 -F-4- Me-Ph,
2-F-4-MeO-Ph、	2 -F-4- MeO-Ph,
2-F-3-Cl-Ph、	2 -F-3- Cl-Ph,
2-F-3-Me-Ph、	2 -F-3- Me-Ph,
2-F-3-MeO-Ph、	2 -F-3- MeO-Ph,
3-F-2-Cl-Ph、	3 -F-2- Cl-Ph,

3-F-2-Me-Ph、	3 -F-2- Me-Ph,
3-F-2-MeO-Ph、	3 -F-2- MeO-Ph,
3-F-4-Cl-Ph、	3 -F-4- Cl-Ph,
3-F-4-Me-Ph、	3 -F-4- Me-Ph,
3-F-4-MeO-Ph、	3 -F-4- MeO-Ph,
3-F-5-Cl-Ph、	3 -F-5-Cl-Ph,
3-F-5-Me-Ph、	3 -F-5-Me-Ph,
3-F-5-MeO-Ph、	3 -F-5-MeO-Ph,
3-F-6-Cl-Ph、	3 -F-6-Cl-Ph,
3-F-6-Me-Ph、	3 -F-6-Me-Ph,
3-F-6-MeO-Ph、	3 -F-6-MeO-Ph,
4-F-2-Cl-Ph、	4 -F-2- Cl-Ph,
4-F-2-Me-Ph、	4 -F-2- Me-Ph,
4-F-2-MeO-Ph、	4 -F-2- MeO-Ph,
4-F-3-Cl-Ph、	4 -F-3- Cl-Ph,
4-F-3-Me-Ph、	4 -F-3- Me-Ph,
4-F-3-MeO-Ph、	4 -F-3- MeO-Ph,
2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph、	2, 4 and 6 -F <sub>3</sub> -Ph,
2-OH-Ph、	2 -OH-Ph,
4-I-Ph、	4 -I-Ph,
4-MeOC(O)-Ph、	4 -MeOC (O ) -Ph,
4-MeNHCO-Ph、	4 -MeNHCO-Ph,
2,6-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -Me <sub>2</sub> -Ph,
2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
4-(6-F-5-CF <sub>3</sub> -2-Pyridyl)-Ph、	4 - ( 6 -F-5-CF <sub>3</sub> -2- Pyridyl ) -Ph,
4-(2-Pyridyl)O-Ph、	4 - ( 2 -Pyridyl ) O-Ph,
4-(5-Cl-2-Pyridyl)O-Ph、	4 - ( 5 -Cl-2- Pyridyl ) O-Ph,
4-(3-Cl-5-F-2-Pyridyl)O-Ph、	4 - ( 3 -Cl-5-F-2- Pyridyl ) O-Ph,
4-(5-Cl-2-Thienyl)O-Ph、	4 - ( 5 -Cl-2- Thienyl ) O-Ph,
3-CF <sub>3</sub> -Ph、	3 -CF <sub>3</sub> -Ph,
2-Br-Ph、	2 -Br-Ph,
3-Br-Ph、	3 -Br-Ph,
2-MeC(O)-Ph、	2 -MeC (O ) -Ph,
2-I-Ph、	2 -I-Ph,
3-I-Ph、	3 -I-Ph,

4-c-Pr-Ph、	4 -c-Pr-Ph,
4-(2-Cl-c-Pr)-Ph、	4 - (2 -Cl-c-Pr ) -Ph,
4-(2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr)-Ph、	4 - (2 and 2 -Cl <sub>2</sub> -c-Pr ) -Ph,
4-(Ph-CH=CH)-Ph、	4 - (Ph-CH=CH ) -Ph,
4-(Ph-C≡C)-Ph、	4 - (Ph-C <sup>*</sup> C ) -Ph,
4-PhS-Ph、	4 -PhS-Ph,
4-HO-Ph、	4 -HO-Ph,
4-EtO-Ph、	4 -EtO-Ph,
4-PenO-Ph、	4 -PenO-Ph,
2-F-3-CF <sub>3</sub> -Ph、	2 -F-3- CF <sub>3</sub> -Ph,
2,3-Me <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 -Me <sub>2</sub> -Ph,
3,4-Me <sub>2</sub> -Ph、	3 and 4 -Me <sub>2</sub> -Ph,
3,5-Me <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 -Me <sub>2</sub> -Ph,
2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 3 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 4 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	2 and 5 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph、	3 and 5 - (MeO ) <sub>2</sub> -Ph,
2-F-3-I-Ph、	2 -F-3- I-Ph,
2-F-4-I-Ph、	2 -F-4- I-Ph,
2-F-5-I-Ph、	2 -F-5-I-Ph,
2-F-6-I-Ph、	2 -F-6-I-Ph,
2-F-4-EtO-Ph、	2 -F-4- EtO-Ph,
2-F-4-PrO-Ph、	2 -F-4- PrO-Ph,
2-F-4-i-PrO-Ph、	2 -F-4- i- PrO-Ph,
2-F-4-BuO-Ph、	2 -F-4- BuO-Ph,
2-F-4-s-BuO-Ph、	2 -F-4- s-BuO-Ph,
2-F-4-i-BuO-Ph、	2 -F-4- i- BuO-Ph,
2-F-4-t-BuO-Ph、	2 -F-4- t-BuO-Ph,
2-F-4-PenO-Ph、	2 -F-4- PenO-Ph,
2-F-4-(2-Me-BuO)-Ph、	2 -F-4- (2 -Me-BuO ) -Ph,
2-F-4-(2,2-Me <sub>2</sub> -PrO)-Ph、	2 -F-4- (2 and 2 -Me <sub>2</sub> -PrO ) -Ph,
2-F-4-HexO-Ph、	2 -F-4- HexO-Ph,
2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph、	2 -F-4- (2 -Et-Hex ) O-Ph,
2-F-4-Et-Ph、	2 -F-4- Et-Ph,
2-F-4-Pr-Ph、	2 -F-4- Pr-Ph,

2-F-4-i-Pr-Ph、	2 -F-4- i- Pr-Ph,
2-F-4-Bu-Ph、	2 -F-4- Bu-Ph,
2-F-4-s-Bu-Ph、	2 -F-4- s-Bu-Ph,
2-F-4-i-Bu-Ph、	2 -F-4- i- Bu-Ph,
2-F-4-t-Bu-Ph、	2 -F-4- t-Bu-Ph,
2-F-4-Pen-Ph、	2 -F-4- Pen-Ph,
2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph、	2 -F-4- (2 -Me-Bu ) -Ph,
2-F-4-(2,2-Me <sub>2</sub> -Pr)-Ph、	2 -F-4- (2 and 2 -Me <sub>2</sub> -Pr ) -Ph,
2-F-4-Hex-Ph、	2 -F-4- Hex-Ph,
2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph、	2 -F-4- (2 -Et-Hex ) -Ph,
2-F-6-PhS-Ph、	2 -F-6-PhS-Ph,
2-F-6-Me <sub>2</sub> N-Ph、	2 -F-6-Me <sub>2</sub> N- Ph,
2-F-6-MeNH-Ph、	2 -F-6-MeNH-Ph,
2-F-6-Ph-Ph、	2 -F-6-Ph-Ph,
3,4-methylenedioxy-Ph、	3 and 4 -methylenedioxy-Ph,
3,4-ethylenedioxy-Ph、	3 and 4 -ethylenedioxy-Ph,
2-F-3-Br-Ph、	2 -F-3- Br-Ph,
2-F-4-Br-Ph、	2 -F-4- Br-Ph,
2-F-5-Br-Ph、	2 -F-5-Br-Ph,
2-F-6-Br-Ph、	2 -F-6-Br-Ph,
3-F-2-Br-Ph、	3 -F-2- Br-Ph,
3-F-4-Br-Ph、	3 -F-4- Br-Ph,
3-F-5-Br-Ph、	3 -F-5-Br-Ph,
3-F-6-Br-Ph、	3 -F-6-Br-Ph,
4-F-2-Br-Ph、	4 -F-2- Br-Ph,
4-F-3-Br-Ph、	4 -F-3- Br-Ph,
2-Cl-3-Me-Ph、	2 -Cl-3- Me-Ph,
2-Cl-4-Me-Ph、	2 -Cl-4- Me-Ph,
2-Cl-5-Me-Ph、	2 -Cl-5-Me-Ph,
2-Cl-6-Me-Ph、	2 -Cl-6-Me-Ph,
3-Cl-2-Me-Ph、	3 -Cl-2- Me-Ph,
3-Cl-4-Me-Ph、	3 -Cl-4- Me-Ph,
3-Cl-5-Me-Ph、	3 -Cl-5-Me-Ph,
3-Cl-6-Me-Ph、	3 -Cl-6-Me-Ph,
4-Cl-2-Me-Ph、	4 -Cl-2- Me-Ph,

4-Cl-3-Me-Ph、	4 -Cl-3- Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4- Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Me-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Me-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3- Me-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Me-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3- Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4- Me-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Me-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Me-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Me-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3- Me-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Me-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Me-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4- Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3- Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Cl-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3- Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4- Cl-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Cl-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Cl-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3- Cl-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Cl-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Cl-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4- MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3- MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-MeO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3- MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4- MeO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-MeO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-MeO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3- MeO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-MeO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- MeO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4- EtO-Ph,

2,3-F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-EtO-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-EtO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-EtO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-EtO-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Et-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Et-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Et-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Et-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Et-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Et-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Et-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -5-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -5-Br-Ph,
2,3-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 3 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -5-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -5-Br-Ph,
2,4-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 4 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,5-F <sub>2</sub> -6-Br-Ph、	2 and 5 -F <sub>2</sub> -6-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -3-Br-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -3-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Br-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Br-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-Pr-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-i-Pr-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-c-Pr-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4-c-Pr-Ph,

2,6-F <sub>2</sub> -4-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- i- Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-s-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- s-Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-t-Bu-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- t-Bu-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Pen-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Pen-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Hex-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Hex-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-Ph-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- Ph-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-PhCH <sub>2</sub> -Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- PhCH <sub>2</sub> -Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-PrO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- PrO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-PrO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- i- PrO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-c-PrO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- c-PrO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-BuO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- BuO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-i-BuO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- i- BuO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-s-BuO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- s-BuO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-t-BuO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- t-BuO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-PenO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- PenO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-HexO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- HexO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-PhO-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- PhO-Ph,
2,6-F <sub>2</sub> -4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph、	2 and 6 -F <sub>2</sub> -4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph,
2-F-6-Cl-3-MeO-Ph、	2 -F-6-Cl-3- MeO-Ph,
2-F-6-Cl-4-MeO-Ph、	2 -F-6-Cl-4- MeO-Ph,
2-F-6-Cl-5-MeO-Ph、	2 -F-6-Cl-5-MeO-Ph,
2-F-6-Cl-3-Me-Ph、	2 -F-6-Cl-3- Me-Ph,
2-F-6-Cl-4-Me-Ph、	2 -F-6-Cl-4- Me-Ph,
2-F-6-Cl-5-Me-Ph、	2 -F-6-Cl-5-Me-Ph,
2-F-6-MeO-3-Cl-Ph、	2 -F-6-MeO-3- Cl-Ph,
2-F-6-MeO-4-Cl-Ph、	2 -F-6-MeO-4- Cl-Ph,
2-F-6-MeO-5-Cl-Ph、	2 -F-6-MeO-5-Cl-Ph,
2-F-6-MeO-3-Me-Ph、	2 -F-6-MeO-3- Me-Ph,
2-F-6-MeO-4-Me-Ph、	2 -F-6-MeO-4- Me-Ph,
2-F-6-MeO-5-Me-Ph、	2 -F-6-MeO-5-Me-Ph,
4-HepO-Ph、	4 -HepO-Ph,
4-OctO-Ph、	4 -OctO-Ph,
4-NonO-Ph、	4 -NonO-Ph,
4-DecO-Ph、	4 -DecO-Ph,



4-UndecO-Ph、

4-DodecO-Ph、

4-Hep-Ph、

4-Oct-Ph、

4-Non-Ph、

4-Dec-Ph、

4-Undec-Ph、4-Dodec-Ph、2-Cl-4-HepO-Ph、  
2-Cl-4-OctO-Ph、2-Cl-4-NonO-Ph、  
2-Cl-4-DecO-Ph、2-Cl-4-UndecO-Ph、  
2-Cl-4-DodecO-Ph、2-Cl-4-Hep-Ph、  
2-Cl-4-Oct-Ph、2-Cl-4-Non-Ph、2-Cl-4-Dec-Ph、  
2-Cl-4-Undec-Ph、2-Cl-4-Dodec-Ph、  
3-Cl-4-HepO-Ph、3-Cl-4-OctO-Ph、  
3-Cl-4-NonO-Ph、3-Cl-4-DecO-Ph、  
3-Cl-4-UndecO-Ph、3-Cl-4-DodecO-Ph、  
3-Cl-4-Hep-Ph、3-Cl-4-Oct-Ph、3-Cl-4-Non-Ph、  
3-Cl-4-Dec-Ph、3-Cl-4-Undec-Ph、  
3-Cl-4-Dodec-Ph、2-F-4-HepO-Ph、  
2-F-4-OctO-Ph、2-F-4-NonO-Ph、  
2-F-4-DecO-Ph、2-F-4-UndecO-Ph、  
2-F-4-DodecO-Ph、2-F-4-Hep-Ph、  
2-F-4-Oct-Ph、2-F-4-Non-Ph、2-F-4-Dec-Ph、  
2-F-4-Undec-Ph、2-F-4-Dodec-Ph、  
3-F-4-HepO-Ph、3-F-4-OctO-Ph、  
3-F-4-NonO-Ph、3-F-4-DecO-Ph、  
3-F-4-UndecO-Ph、3-F-4-DodecO-Ph、  
3-F-4-Hep-Ph、3-F-4-Oct-Ph、3-F-4-Non-Ph、  
2-Cl-3-MeO-Ph、2-Cl-4-MeO-Ph、  
2-Cl-5-MeO-Ph、2-Cl-6-MeO-Ph、  
3-Cl-2-MeO-Ph、3-Cl-4-MeO-Ph、  
3-Cl-5-MeO-Ph、3-Cl-6-MeO-Ph、  
4-Cl-2-MeO-Ph、4-Cl-3-MeO-Ph、  
2-Me-3-MeO-Ph、2-Me-4-MeO-Ph、  
2-Me-5-MeO-Ph、2-Me-6-MeO-Ph、  
3-Me-2-MeO-Ph、3-Me-4-MeO-Ph、  
3-Me-5-MeO-Ph、3-Me-6-MeO-Ph、  
4-Me-3-MeO-Ph、3-F-4-Dec-Ph、  
3-F-4-Undec-Ph、3-F-4-Dodec-Ph および  
2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph 等があげられる。

【0089】

Y' における、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

4 -UndecO-Ph,

4 -DodecO-Ph,

4 -Hep-Ph,

4 -Oct-Ph,

4 -Non-Ph,

4 -Dec-Ph,

You can list 4 -Undec-Ph, 4- Dodec-Ph, 2- Cl-4- HepO-Ph, 2- Cl-4- OctO-Ph, 2- Cl-4- NonO-Ph, 2- Cl-4- DecO-Ph, 2- Cl-4- UndecO-Ph, 2- Cl-4- DodecO-Ph, 2- Cl-4- Hep-Ph, 2- Cl-4- Oct-Ph, 2- Cl-4- Non-Ph, 2- Cl-4- Dec-Ph, 2- Cl-4- Undec-Ph, 2- Cl-4- Dodec-Ph, 3- Cl-4- HepO-Ph, 3- Cl-4- OctO-Ph, 3- Cl-4- NonO-Ph, 3- Cl-4- DecO-Ph, 3- Cl-4- UndecO-Ph, 3- Cl-4- DodecO-Ph, 3- Cl-4- Hep-Ph, 3- Cl-4- Oct-Ph, 3- Cl-4- Non-Ph, 3- Cl-4- Dec-Ph, 3- Cl-4- Undec-Ph, 3- Cl-4- Dodec-Ph, 2- F-4- HepO-Ph, 2- F-4- OctO-Ph, 2- F-4- NonO-Ph, 2- F-4- DecO-Ph, 2- F-4- UndecO-Ph, 2- F-4- DodecO-Ph, 2- F-4- Hep-Ph, 2- F-4- Oct-Ph, 2- F-4- Non-Ph, 2- F-4- Dec-Ph, 2- F-4- Undec-Ph, 2- F-4- Dodec-Ph, 3- F-4- HepO-Ph, 3- F-4- OctO-Ph, 3- F-4- NonO-Ph, 3- F-4- DecO-Ph, 3- F-4- UndecO-Ph, 3- F-4- DodecO-Ph, 3- F-4- Hep-Ph, 3- F-4- Oct-Ph, 3- F-4- Non-Ph, 2- Cl-3- MeO-Ph, 2- Cl-4- MeO-Ph, 2- Cl-5-MeO-Ph, 2- Cl-6-MeO-Ph, 3- Cl-2- MeO-Ph, 3- Cl-4- MeO-Ph, 3- Cl-5-MeO-Ph, 3- Cl-6-MeO-Ph, 4- Cl-2- MeO-Ph, 4- Cl-3- MeO-Ph, 2- Me-3- MeO-Ph, 2- Me-4- MeO-Ph, 2- Me-5-MeO-Ph, 2- Me-6-MeO-Ph, 3- Me-2- MeO-Ph, 3- Me-4- MeO-Ph, 3- Me-5-MeO-Ph, 3- Me-6-MeO-Ph, 4- Me-3- MeO-Ph, 3- F-4- Dec-Ph, 3- F-4- Undec-Ph, 3- F-4- Dodec-Ph and 2, 4 and 6 -Me<sub>3</sub>-Ph etc.

【0089】

In Y\*,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulphenyl ,

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルおよび R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシで定義される、R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-*t*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

#### [0090]

Y' の定義における、R<sup>c</sup> で置換されていてもよいフェニル C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-*t*-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロ

With R<sup>c</sup> optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl ,

With R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl and R<sup>c</sup> it is defined with the optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl carbonyl oxy , as optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl with R<sup>c</sup> , benzyl , 2- chloro benzyl , 3- bromo benzyl , 4- chloro benzyl , 4- methylbenzyl , 4- *t*-butyl benzyl , 2- methylbenzyl , 2- methoxy benzyl , 1- phenylethyl , 1- (3 -chlorophenyl ) ethyl , 2- phenylethyl , 1- methyl -1- phenylethyl , 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl , 1- (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl , 1- phenyl propyl , 2- phenyl propyl , 3- phenyl propyl , 1- phenyl butyl , 2- phenyl butyl , 3- phenyl butyl , 4- phenyl butyl , 1- methyl -1- phenyl propyl , 1- methyl -2- phenyl propyl , 1- methyl -3- phenyl propyl , 2- methyl -2- phenyl propyl , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl , 1- phenyl pentyl , 2- phenyl pentyl , 3- phenyl pentyl , 4- phenyl pentyl , 5-phenyl pentyl , 1- methyl -1- phenyl butyl , 1- methyl -2- phenyl butyl , 1- methyl -3- phenyl butyl , 1- methyl -4- phenyl butyl , 2- methyl -2- phenyl butyl , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl , 1- phenyl hexyl , 2- phenyl hexyl , 3- phenyl hexyl , 4- phenyl hexyl , 5-phenyl hexyl , 6-phenyl hexyl , 1- methyl -1- phenyl pentyl , 1- methyl -2- phenyl pentyl , 1- methyl -3- phenyl pentyl , 1- methyl -4- phenyl pentyl , 2- methyl -2- phenyl pentyl , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyl and 2 -methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyl etc as phenyl alkyl of straight chain or branched .

#### [0090]

benzyloxy , 2- chloro benzyloxy , 3- bromo benzyloxy , 4- chloro benzyloxy , 4- methylbenzyl oxy , 4- *t*-butyl benzyloxy , 2- methylbenzyl oxy , 2- methoxy benzyloxy , 1- phenylethyl oxy , 1- (3 -chlorophenyl ) ethyl oxy , 2- phenylethyl oxy , 1- methyl -1- phenylethyl oxy , 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy , 1- (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy , 1- phenyl propyl oxy , 2- phenyl propyl oxy , 3- phenyl propyl oxy , 1- phenyl butyl oxy , 2- phenyl butyl oxy , 3- phenyl butyl oxy , 4- phenyl butyl oxy , 1- methyl -1- phenyl propyl oxy , 1- methyl -2- phenyl propyl oxy , 1- methyl -3- phenyl propyl oxy , 2- methyl -2- phenyl propyl oxy , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl -propyl oxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl oxy , 1- phenyl

ロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチル-プロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

## 【0091】

Y'における、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシおよび R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシカルボニルで定義される、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロフェノキシ、2-ブロモフェノキシ、3-ブロモフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび 4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

## 【0092】

Y'における、

pentyl oxy, 2- phenyl pentyl oxy, 3- phenyl pentyl oxy, 4- phenyl pentyl oxy, 5-phenyl pentyl oxy, 1- methyl -1- phenyl butyl oxy, 1- methyl -2- phenyl butyl oxy, 1- methyl -3- phenyl butyl oxy, 1- methyl -4- phenyl butyl oxy, 2- methyl -2- phenyl butyl oxy, 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl oxy, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl oxy, 1- phenyl hexyloxy, 2- phenyl hexyloxy, 3- phenyl hexyloxy, 4- phenyl hexyloxy, 5-phenyl hexyloxy, 6-phenyl hexyloxy, 1- methyl -1- phenyl pentyloxy, 1- methyl -2- phenyl pentyloxy, 1- methyl -3- phenyl pentyloxy, 1- methyl -4- phenyl pentyloxy, 2- methyl -2- phenyl pentyloxy, 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyloxy and 2 -methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyloxy etc as phenyl alkoxy of straight chain or branched as optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy with the R<sup>c</sup>, in defining Y\*.

## 【0091】

In Y\*, with R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenoxy and R<sup>c</sup> it is defined with optionally substitutable phenoxy carbonyl, you can list phenoxy, 2- fluorophenoxy, 3- fluorophenoxy, 4- fluorophenoxy, 2- chlorophenoxy, 3- chlorophenoxy, 4- chlorophenoxy, 2- bromo phenoxy, 3- bromo phenoxy, 4- bromo phenoxy, 4- iodo phenoxy, 2, 4- dichloro phenoxy, 3, 4- dichloro phenoxy, 2, 6-difluoro phenoxy, 2, 6-dichloro phenoxy, 2- fluoro -4- chlorophenoxy, 2, 3, 4, 5, 6-penta fluorophenoxy, 2- methyl phenoxy, 3- methyl phenoxy, 4- methyl phenoxy, 2, 5-dimethyl phenoxy, 4- methyl -2, 3, 5, 6-tetrafluoro phenoxy, 2- methoxy phenoxy, 3- methoxy phenoxy, 4- methoxy phenoxy, 2, 6-dimethoxy phenoxy, 3, 4- dimethoxy phenoxy, 3, 4, 5-trimethoxy phenoxy, 2- trifluoromethyl phenoxy, 3- trifluoromethyl phenoxy and 4 -trifluoromethyl phenoxy etc with R<sup>c</sup> as optionally substitutable phenoxy .

## 【0092】

In Y\*,

R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール、  
R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールスル  
フィニル、  
R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールスル  
フェニル、  
R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールスル  
ホニル、  
R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールカル  
ボニルおよび R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロ  
アリールカルボニルオキシで定義される、  
R<sup>°</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールとして  
は、  
2-フルオロフラン-3-イル、  
3-シアノピロール-1-イル、  
オキサゾール-2-イル、  
2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、  
2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-  
イル、  
2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イル、  
1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、  
1,2,4-チアジアゾール-5-イル、  
1,2,4-トリアゾール-1-イル、  
1,2,3-トリアゾール-1-イル、  
1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、  
6-メトキシピリミジン-2-イル、  
ピリダジン-3-イル、  
1,3,5-トリアジン-2-イル、  
1,2,4-トリアジン-6-イル、  
1-メチルピラゾール-5-イル、  
1-メチルピラゾール-4-イル、  
1-メチルピラゾール-3-イル、  
1-フェニルピラゾール-5-イル、  
1-フェニルピラゾール-4-イル、  
1-フェニルピラゾール-3-イル、  
1-メチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、  
1-メチル-4-フルオロピラゾール-3-イル、  
1-メチル-3-フルオロピラゾール-4-イル、

With R<sup><sup>c</sup></sup> optionally substitutable heteroaryl ,  
With R<sup><sup>c</sup></sup> optionally substitutable heteroaryl  
sulfinyl ,  
With R<sup><sup>c</sup></sup> optionally substitutable heteroaryl  
sulfenyl ,  
With R<sup><sup>c</sup></sup> optionally substitutable heteroaryl  
sulfonyl ,  
With R<sup><sup>c</sup></sup> with optionally substitutable heteroaryl  
carbonyl and R<sup><sup>c</sup></sup> it is defined with the optionally  
substitutable heteroaryl carbonyl oxy ,  
With R<sup><sup>c</sup></sup> as optionally substitutable heteroaryl ,  
2 -fluoro furan -3- yl ,  
3 -cyanopyrrole -1- yl ,  
oxazole -2- yl ,  
2 -methyl sulfenyl oxazole -4- yl ,  
2 -methyl sulfonyl -1, 3, 4- oxadiazole -5-yl ,  
2 -bromo -1, 3, 4- thiadiazole -5-yl ,  
1, 2 and 4 -oxadiazole -3- yl ,  
1, 2 and 4 -thiadiazole -5-yl ,  
1, 2 and 4 -triazole -1- yl ,  
1, 2 and 3 -triazole -1- yl ,  
1, 2, 3 and 4 -tetrazole -1- yl ,  
6 -methoxy pyrimidine -2- yl ,  
pyridazine -3- yl ,  
1, 3 and 5 -triazine -2- yl ,  
1, 2 and 4 -triazine -6-yl ,  
1 -methyl pyrazole -5-yl ,  
1 -methyl pyrazole -4- yl ,  
1 -methyl pyrazole -3- yl ,  
1 -phenylpyrazole -5-yl ,  
1 -phenylpyrazole -4- yl ,  
1 -phenylpyrazole -3- yl ,  
1 -methyl -4- fluoro pyrazole -5-yl ,  
1 -methyl -4- fluoro pyrazole -3- yl ,  
1 -methyl -3- fluoro pyrazole -4- yl ,

1-メチル-3-フルオロピラゾール-5-イル、	1-methyl -3- fluoro pyrazole -5-yl ,
1-メチル-5-フルオロピラゾール-3-イル、	1-methyl -5-fluoro pyrazole -3- yl ,
1-メチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、	1-methyl -5-fluoro pyrazole -4- yl ,
1-メチル-4-クロロピラゾール-5-イル、	1-methyl -4- chloro pyrazole -5-yl ,
1-メチル-4-クロロピラゾール-3-イル、	1-methyl -4- chloro pyrazole -3- yl ,
1-メチル-3-クロロピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- chloro pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イル、	1-methyl -3- chloro pyrazole -5-yl ,
1-メチル-5-クロロピラゾール-3-イル、	1-methyl -5-chloro pyrazole -3- yl ,
1-メチル-5-クロロピラゾール-4-イル、	1-methyl -5-chloro pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-ブロモピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- bromo pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-フェニルピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- phenylpyrazole -4- yl ,
1-メチル-5-ニトロピラゾール-4-イル、	1-methyl -5-nitro pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- trifluoromethyl pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- difluoro chloromethyl pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、	1-methyl -3- trifluoromethyl -5-methoxy pyrazole -4- yl ,
1-メチル-5-トリフルオロメチルピラゾール-3-イル、	1-methyl -5-trifluoromethyl pyrazole -3- yl ,
1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、	1-methyl -4- methoxycarbonyl pyrazole -5-yl ,
1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、	1-methyl -4- methoxycarbonyl pyrazole -3- yl ,
1-メチル-5-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、	1-methyl -5-methoxycarbonyl pyrazole -3- yl ,
1-メチル-3-クロロ-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、	1-methyl -3- chloro -4- methoxycarbonyl pyrazole -5-yl ,
1-メチル-3-クロロ-4-エトキシカルボニルピラゾール-5-イル、	1-methyl -3- chloro -4- ethoxy carbonyl pyrazole -5-yl ,
1-メチル-4-エトキシカルボニルピラゾール-3-イル、	1-methyl -4- ethoxy carbonyl pyrazole -3- yl ,
1,4-ジメチルピラゾール-5-イル、	1 and 4 -dimethyl pyrazole -5-yl ,
1,4-ジメチルピラゾール-3-イル、	1 and 4 -dimethyl pyrazole -3- yl ,
1,3-ジメチルピラゾール-4-イル、	1 and 3 -dimethyl pyrazole -4- yl ,
1,3-ジメチルピラゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl pyrazole -5-yl ,
1,5-ジメチルピラゾール-3-イル、	1 and 5 -dimethyl pyrazole -3- yl ,
1,5-ジメチルピラゾール-4-イル、	1 and 5 -dimethyl pyrazole -4- yl ,

1,5-ジメチル-4-クロロピラゾール-3-イル、	1 and 5 -dimethyl -4- chloro pyrazole -3- yl ,
1,3-ジメチル-5-クロロピラゾール-4-イル、	1 and 3 -dimethyl -5-chloro pyrazole -4- yl ,
1,3-ジメチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、	1 and 3 -dimethyl -5-fluoro pyrazole -4- yl ,
1,3-ジメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、	1 and 3 -dimethyl -5-methoxy pyrazole -4- yl ,
1,3,5-トリメチルピラゾール-4-イル、	1, 3 and 5 -trimethyl pyrazole -4- yl ,
1,3-ジメチル-4-クロロピラゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl -4- chloro pyrazole -5-yl ,
1,3-ジメチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl -4- fluoro pyrazole -5-yl ,
1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl -4- nitro pyrazole -5-yl ,
1,3-ジメチル-4-メトキシピラゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl -4- methoxy pyrazole -5-yl ,
1-メチル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、	1 -methyl -3, 5-dichloro pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、	1 -methyl -3, 5-difluoro pyrazole -4- yl ,
1-フェニル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、	1 -phenyl -3, 5-dichloro pyrazole -4- yl ,
1-フェニル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、	1 -phenyl -3, 5-difluoro pyrazole -4- yl ,
1-(2-ピリジル)-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、	1 - (2 -pyridyl ) - 3 and 5 -dichloro pyrazole -4- yl ,
1-フェニル-5-メチルピラゾール-4-イル、	1 -phenyl -5-methyl pyrazole -4- yl ,
1-フェニル-5-トリフルオロメチルピラゾール-4-イル、	1 -phenyl -5-trifluoromethyl pyrazole -4- yl ,
1-フェニル-5-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、	1 -phenyl -5-difluoro chloromethyl pyrazole -4- yl ,
1-t-ブチル-5-メチルピラゾール-4-イル、	1 -t-butyl -5-methyl pyrazole -4- yl ,
1-メチル-3-クロロ-5-メチルチオピラゾール-4-イル、	1 -methyl -3- chloro -5-methylthio pyrazole -4- yl ,
1-メチル-ピロール-2-イル、	1 -methyl -pyrrole -2- yl ,
1-メチル-ピロール-3-イル、	1 -methyl -pyrrole -3- yl ,
1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-5-イル、	1 -methyl -4- trifluoromethyl pyrrole -5-yl ,
フラン-2-イル、	furan -2- yl ,
フラン-3-イル、	furan -3- yl ,
5-メチルフラン-2-イル、	5 -methyl furan -2- yl ,
5-フェニルフラン-2-イル、	5 -phenyl furan -2- yl ,
2,5-ジメチルフラン-3-イル、	2 and 5 -dimethyl furan -3- yl ,
2,4-ジメチルフラン-3-イル、	2 and 4 -dimethyl furan -3- yl ,
チオフェン-2-イル、	thiophene -2- yl ,
チオフェン-3-イル、	thiophene -3- yl ,
5-フェニルチオフェン-2-イル、	5 - [feniruchiofen ] - 2 -yl ,
5-メチルチオフェン-2-イル、	5 -methyl thiophene -2- yl ,
5-ブロモチオフェン-2-イル、	5 -bromo thiophene -2- yl ,

3-ブロモチオフェン-2-イル、	3 -bromo thiophene -2- yl ,
4,5-ジブロモチオフェン-2-イル、	4 and 5 -dibromo thiophene -2- yl ,
5-ヨードチオフェン-2-イル、	5 -iodo thiophene -2- yl ,
5-クロロチオフェン-2-イル、	5 -chloro thiophene -2- yl ,
5-フェニル-2-メチルチオフェン-3-イル、	5 -phenyl -2- methyl thiophene -3- yl ,
5-ニトロチオフェン-3-イル、	5 -nitro thiophene -3- yl ,
3-メチルチオフェン-2-イル、	3 -methyl thiophene -2- yl ,
3-クロロチオフェン-2-イル、	3 -chloro thiophene -2- yl ,
3-メトキシチオフェン-2-イル、	3 -methoxy thiophene -2- yl ,
3-フルオロチオフェン-2-イル、	3 -fluoro thiophene -2- yl ,
チアゾール-4-イル、	thiazole -4- yl ,
チアゾール-5-イル、	thiazole -5-yl ,
チアゾール-2-イル、	thiazole -2- yl ,
2,4-ジメチルチアゾール-5-イル、	2 and 4 -dimethyl thiazole -5-yl ,
2-ブロモ-4-メチルチアゾール-5-イル、	2 -bromo -4- methyl thiazole -5-yl ,
2-クロロ-4-メチルチアゾール-5-イル、	2 -chloro -4- methyl thiazole -5-yl ,
2-クロロ-4-エチルチアゾール-5-イル、	2 -chloro -4- ethyl thiazole -5-yl ,
2-クロロ-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、	2 -chloro -4- trifluoromethyl thiazole -5-yl ,
2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、	2 -methyl -4- trifluoromethyl thiazole -5-yl ,
2-メチル-4-エチルチアゾール-5-イル、	2 -methyl -4- ethyl thiazole -5-yl ,
2-ブロモ-4-エチルチアゾール-5-イル、	2 -bromo -4- ethyl thiazole -5-yl ,
2-エチル-4-メチルチアゾール-5-イル、	2 -ethyl -4- methyl thiazole -5-yl ,
2-メトキシ-4-メチルチアゾール-5-イル、	2 -methoxy -4- methyl thiazole -5-yl ,
2-クロロ-4-フルオロチアゾール-5-イル、	2 -chloro -4- fluoro thiazole -5-yl ,
2-フェニル-4-エトキシカルボニルチアゾール-5-イル、	2 -phenyl -4- ethoxy carbonyl thiazole -5-yl ,
2-クロロチアゾール-4-イル、	2 -chloro thiazole -4- yl ,
2-メチルチアゾール-4-イル、	2 -methyl thiazole -4- yl ,
1-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル、	1 -phenyl -5-methyl oxazole -4- yl ,
1,3-ジメチルオキサゾール-5-イル、	1 and 3 -dimethyl oxazole -5-yl ,
3-メチルイソチアゾール-5-イル、	3 -methyl isothiazole -5-yl ,
3-ベンジルオキシ-5-メチルイソチアゾール-4-イル、	3 -benzyloxy -5-methyl isothiazole -4- yl ,
4-クロロ-5-エトキシカルボニルイソチアゾール-3-イル、	4 -chloro -5-ethoxy carbonyl isothiazole -3- yl ,

イソオキサゾール-5-イル、

3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル、

5-メチルイソオキサゾール-3-イル、3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル、4-シアノイソオキサゾール-3-イル、1-メチルイミダゾール-5-イル、1-メチル-4,5-ジクロロイミダゾール-2-イル、1,5-ジメチル-2-クロロイミダゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-エチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-ジブロモメチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、4-エチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、6-メチルピリジン-3-イル、6-クロロピリジン-2-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、2-クロロピリジン-4-イル、2-フルオロピリジン-4-イル、2,6-ジクロロピリジン-4-イル、2-メトキシピリジン-4-イル、3,6-ジクロロピリジン-2-イル、2-クロロ-6-メチルピリジン-4-イル、3-フルオロピリジン-2-イル、3-フルオロピリジン-4-イル、キノキサリン-2-イル、6-クロロキノキサリン-2-イル、6-フルオロキノキサリン-2-イル、6-メトキシキノキサリン-2-イル、5-クロロキノキサリン-2-イル、5-フルオロキノキサリン-2-イル、5-メトキシキノキサリン-2-イル、1-メチルインドール-3-イル、1-メチル-2-クロロインドール-3-イル、1-メチル-2-フルオロインドール-3-イル、ベンゾチアゾール-2-イル、5-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、6-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、キノリン-4-イル、ピラジン-2-イル、3-クロロピラジン-2-イル、3-メチルピラジン-2-イル、3-エチルピラジン-2-イル、2-フェニル-4-メチルピリミジン-5-イル、2,4-ジメチルピリミジン-5-イル、4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル、4-ジフルオロクロメチルピリミジン-5-イル、4-ペンタフルオロエチルピリミジン-5-イル、4-メチルチオピリミジン-5-イル、4-ブロモジフルオロメチルピリミジン-5-イルおよび 2-メチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル等が挙げられる。

【0093】

Y' の定義における R<sup>c</sup> で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキ

isoxazole -5-yl ,

3 and 5 -dimethyl isoxazole -4- yl ,

You can list 5 -methylisoxazole -3- yl , 3- phenyl -5-methylisoxazole -4- yl , 4- cyano isoxazole -3- yl , 1- methyl imidazole -5-yl , 1- methyl -4, 5-dichloro imidazole -2- yl , 1, 5-dimethyl -2- chloroimidazole -4- yl , 1- phenyl -5-methyl -1, 2, 3- triazole -4- yl , 1- phenyl -5-ethyl -1, 2, 3- triazole -4- yl , 1- phenyl -5-dibromo methyl -1, 2, 3- triazole -4- yl , 4- methyl -1, 2, 3- thiadiazole -5-yl , 4- ethyl -1, 2, 3- thiadiazole -5-yl , 1, 2, 3- thiadiazole -5-yl , 1, 2, 3- thiadiazole -4- yl , pyridine -2- yl , pyridine -3- yl , pyridine -4- yl , 6-methylpyridine -3- yl , 6-chloropyridine -2- yl , 6-phenoxy pyridine -2- yl , 2- chloropyridine -4- yl , 2- fluoro pyridine -4- yl , 2, 6-dichloropyridine -4- yl , 2- methoxy pyridine -4- yl , 3, 6-dichloropyridine -2- yl , 2- chloro -6-methylpyridine -4- yl , 3- fluoro pyridine -2- yl , 3- fluoro pyridine -4- yl , quinoxaline -2- yl , 6-chloro quinoxaline -2- yl , 6-fluoro quinoxaline -2- yl , 6-methoxy quinoxaline -2- yl , 5-chloro quinoxaline -2- yl , 5-fluoro quinoxaline -2- yl , 5-methoxy quinoxaline -2- yl , 1- methyl indole -3- yl , 1- methyl -2- chloro indole -3- yl , 1- methyl -2- fluoro indole -3- yl , benzothiazole -2- yl , 5-fluoro benzothiazole -2- yl , 6-fluoro benzothiazole -2- yl , quinoline -4- yl , pyrazine -2- yl , 3- chloro pyrazine -2- yl , 3- methyl pyrazine -2- yl , 3- ethyl pyrazine -2- yl , 2- phenyl -4- methyl pyrimidine -5-yl , 2, 4- dimethyl pyrimidine -5-yl , 4- trifluoromethyl pyrimidine -5-yl , 4- difluoro chloromethyl pyrimidine -5-yl , 4- pentafluoroethyl pyrimidine -5-yl , 4- methylthio pyrimidine -5-yl , 4- bromo difluoromethyl pyrimidine -5-yl and 2 -methyl -4- chloro difluoromethyl pyrimidine -5-yl etc.

【0093】

As optionally substitutable heteroaryl

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy with R<sup>c</sup> in defining Y\*, you can list the pyridine -2- yl methyl oxy , 5-chloro thiophene -2- yl methyl oxy , 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl oxy , 2- (3 -methyl furan -2- yl ) ethyl oxy , 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl oxy , 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl oxy , 5- (triazole -1- yl ) pentyloxy and 6 - (pyrrole -1- yl ) hexyloxy etc as heteroaryl alkoxy of straight chain or branched .



シルオキシ等が挙げられる。

【0094】

Y'における、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルおよび R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシで定義される、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリール C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

【0095】

Y'における、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールオキシおよび R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルで定義される、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリールオキシとしては、5-クロロチオフェン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-1-メチルピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび 1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

【0094】

You can list pyridine -2- yl methyl , 5-chloro thiophene -2- yl methyl , 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl , 2- (3 -methyl furan -2- yl ) ethyl , 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl , 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl , 5- (triazole -1- yl ) pentyl and 6 - the(pyrrole -1- yl ) hexyl etc as heteroaryl alkyl of straight chain or branched as optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl with R<sup>c</sup>, in Y\*, with R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfenyl , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl , R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl and R<sup>c</sup> it is defined with the optionally substitutable heteroaryl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy .

【0095】

In Y\*, with R<sup>c</sup> with optionally substitutable heteroaryloxy and R<sup>c</sup> it is defined with optionally substitutable heteroaryloxy carbonyl , you can list 5 -chloro thiophene -2- yloxy , 3, 5-dimethyl furan -2- yloxy , 3- cyano -1- methyl pyrrole -1- yloxy , oxazole -2- yloxy , 2- methyl sulfenyl oxazole -4- yloxy , 4- methyl thiazole -2- yloxy , 2- trifluoromethyl imidazole -4- yloxy , isoxazole -3- yloxy , 3- chloro isoxazole -4- yloxy , 3- methyl isothiazole -5-yloxy , 1- benzyl -3- phenylpyrazole -5-yloxy , 1- methyl pyrazole -5-yloxy , 2- methyl sulfonyl -1, 3, 4- oxadiazole -5-yloxy , 2- bromo -1, 3, 4- thiadiazole -5-yloxy , 1, 2, 4- oxadiazole -3- yloxy , 1, 2, 4- thiadiazole -5-yloxy , 1, 2, 4- triazole -3- yloxy , 1, 2, 3- thiadiazole -5-yloxy , 1, 2, 3- triazole -5-yloxy , 1, 2, 3, 4- tetrazole -5-yloxy , 6-phenoxy pyridine -2- yloxy , 6-methoxy pyrimidine -2- yloxy , pyrazine -2- yloxy , pyridazine -3- yloxy , 1, 3, 5-triazine -2- yloxy and 1, 2 and 4 -triazine -6-yloxy etc with R<sup>c</sup> as optionally substitutable heteroaryloxy .

【0096】

Y' の定義におけるナフチルとしては、1-ナフチルおよび 2-ナフチルがあげられる。

【0097】

R<sup>c</sup> および Y' における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルおよび R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシで定義される、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルとしては、

直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、

エチル、

n-プロピル、

i-プロピル、

n-ブチル、

i-ブチル、

t-ブチル、

s-ブチル、

n-ペンチル、

n-ヘキシル、

2-エチルプロピル、

2,2-ジメチルプロピル、

1,2-ジメチルプロピル、

1,1,2-トリメチルプロピル、

1,2,2-トリメチルプロピル、

1-エチル-1-メチルプロピル、

1-エチル-2-メチルプロピル、

1-メチルブチル、

2-メチルブチル、

3-メチルブチル、

1,1-ジメチルブチル、

1,2-ジメチルブチル、

【0096】

It can increase 1 -naphthyl and 2 -naphthyl as naphthyl in defining the Y\*.

【0097】

With R<sup>b</sup> in R<sup>c</sup> and Y\* optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulphenyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl ,

With R<sup>b</sup> optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl ,

With R<sup>b</sup> with optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl and R<sup>b</sup> it is defined with the optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl carbonyl oxy ,

With R<sup>b</sup> as optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl ,

As alkyl of straight chain or branched methyl ,

ethyl ,

n- propyl ,

i-propyl ,

n- butyl ,

i- butyl ,

t-butyl ,

s-butyl ,

n- pentyl ,

n- hexyl ,

2 -ethyl propyl ,

2 and 2 -dimethyl propyl ,

1 and 2 -dimethyl propyl ,

1, 1 and 2 -trimethylpropyl ,

1, 2 and 2 -trimethylpropyl ,

1 -ethyl -1- methylpropyl ,

1 -ethyl -2- methylpropyl ,

1 -methyl butyl ,

2 -methyl butyl ,

3 -methyl butyl ,

1 and 1 -dimethylbutyl ,

1 and 2 -dimethylbutyl ,

1,3-ジメチルブチル、	1 and 3 -dimethylbutyl ,
2,2-ジメチルブチル、	2 and 2 -dimethylbutyl ,
2,3-ジメチルブチル、	2 and 3 -dimethylbutyl ,
3,3-ジメチルブチル、	3 and 3 -dimethylbutyl ,
1-エチルブチル、	1 -ethyl butyl ,
2-エチルブチル、	2 -ethyl butyl ,
1-メチルペンチル、	1 -methyl pentyl ,
2-メチルペンチル、	2 -methyl pentyl ,
3-メチルペンチル、	3 -methyl pentyl ,
4-メチルペンチル、	4 -methyl pentyl ,
フルオロメチル、	fluoromethyl ,
クロロメチル、	chloromethyl ,
ブロモメチル、	bromomethyl ,
ヨードメチル、	iodomethyl ,
ジフルオロメチル、	difluoromethyl ,
クロロジフルオロメチル、	chloro difluoromethyl ,
ブロモジフルオロメチル、	bromo difluoromethyl ,
トリフルオロメチル、	trifluoromethyl ,
ジクロロメチル、	dichloro methyl ,
トリクロロメチル、	trichloromethyl ,
1-クロロエチル、	1 -chloroethyl ,
1-ブロモエチル、	1 -bromoethyl ,
1-ヨードエチル、	1 -iodoethyl ,
1-フルオロエチル、	1 -fluoro ethyl ,
2-クロロエチル、	2 -chloroethyl ,
2-ブロモエチル、	2 -bromoethyl ,
2-ヨードエチル、	2 -iodoethyl ,
2-フルオロエチル、	2 -fluoro ethyl ,
2,2-ジフルオロエチル、	2 and 2 -difluoro ethyl ,
2,2,2-トリフルオロエチル、	2, 2 and 2 -trifluoroethyl ,
2,2,2-トリクロロエチル、	2, 2 and 2 -trichloroethyl ,
ペンタフルオロエチル、	pentafluoroethyl ,
2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、	2, 2 and 2 -trifluoro -1- chloroethyl ,
3-フルオロプロピル、	3 -fluoropropyl ,
3-クロロプロピル、	3 -chloropropyl ,

1-フルオロ-i-プロピル、	1 -fluoro -i-propyl ,
1-クロロ-i-プロピル、	1 -chloro -i-propyl ,
ヘptaフルオロプロピル、	heptafluoro propyl ,
1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、	1, 1, 2, 2, 3 and 3 -hexafluoropropyl ,
4-クロロブチル、	4 -chloro butyl ,
4-フルオロブチル、	4 -fluoro butyl ,
5-クロロペンチル、	5 -chloro pentyl ,
5-フルオロペンチル、	5 -fluoro pentyl ,
6-クロロヘキシル、	6 -chloro hexyl ,
6-フルオロヘキシル、	6 -fluoro hexyl ,
メトキシメチル、	methoxymethyl ,
エトキシメチル、	ethoxymethyl ,
n-プロポキシメチル、	n- propoxy methyl ,
i-プロポキシメチル、	i- propoxy methyl ,
n-ブトキシメチル、	n- butoxy methyl ,
i-ブトキシメチル、	i- butoxy methyl ,
s-ブトキシメチル、	s-butoxy methyl ,
t-ブトキシメチル、	t-butoxy methyl ,
n-ペンチルオキシメチル、	n- pentyloxy methyl ,
2-メトキシエチル、	2 -methoxyethyl ,
3-エトキシプロピル、	3 -ethoxy propyl ,
3-メトキシプロピル、	3 -methoxypropyl ,
メチルチオメチル、	methylthio methyl ,
エチルチオメチル、	ethyl thio methyl ,
n-プロピルチオメチル、	n- propyl thio methyl ,
i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピル、3-メチルチオプロピル、ベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル	i-propyl thio methyl , n- butyl thio methyl , i- butyl thio methyl , s-butyl thio methyl , t-butyl thio methyl , n- pentyl thio methyl , 2- methylthio ethyl , 3- ethyl thio propyl , 3- methylthio propyl , benzyl , 2- chloro benzyl , 3- bromo benzyl , 4- chloro benzyl , 4- methylbenzyl , 4- t-butyl benzyl , 2- methylbenzyl , 2- methoxy benzyl , 1- phenylethyl , 1- (3 -chlorophenyl ) ethyl , 2- phenylethyl , 1- methyl -1- phenylethyl , 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl , 1- (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl , 1- phenyl propyl , 2- phenyl propyl , 3- phenyl propyl , 1- phenyl butyl , 2- phenyl butyl , 3- phenyl butyl , 4- phenyl butyl , 1- methyl -1- phenyl propyl , 1- methyl -2- phenyl propyl , 1- methyl -3- phenyl propyl , 2- methyl -2- phenyl propyl , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl , 1- phenyl pentyl , 2- phenyl pentyl ,

ル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル、ピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

[0098]

R<sup>a</sup> および Y' における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルフェニル、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルフィニルおよび R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルスルホニルで定義される、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル

3-phenyl pentyl, 4-phenyl pentyl, 5-phenyl pentyl, 1-methyl -1- phenyl butyl, 1- methyl -2- phenyl butyl, 1- methyl -3- phenyl butyl, 1- methyl -4- phenyl butyl, 2- methyl -2- phenyl butyl, 2- (4 -chlorophenyl) - 2 -methyl butyl, 2- methyl -2- (3 -methylphenyl) butyl, 1- phenyl hexyl, 2- phenyl hexyl, 3- phenyl hexyl, 4- phenyl hexyl, 5-phenyl hexyl, 6-phenyl hexyl, 1- methyl -1- phenyl pentyl, 1- methyl -2- phenyl pentyl, 1- methyl -3- phenyl pentyl, 1- methyl -4- phenyl pentyl, 2- methyl -2- phenyl pentyl, 2- (4 -chlorophenyl) - 2 -methyl pentyl, 2- methyl -2- you can list (3 -methylphenyl) pentyl, pyridine -2- yl methyl, 5-chloro thiophene -2- yl methyl, 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl, 2- (3 -methyl furan -2- yl) ethyl, 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl) propyl, 4- (pyrimidine -2- yl) butyl, 5- (triazole -1- yl) pentyl and 6- (pyrrole -1- yl) hexyl etc.

[0098]

With R<sup>a</sup> in R<sup>b</sup> and Y\* optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl oxy,

With R<sup>a</sup> optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfenyl,

With R<sup>a</sup> with optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfinyl and R<sup>b</sup> it is defined with the optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl sulfonyl,

As optionally substitutable

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl with R<sup>a</sup>, you can list ethenyl, 1- propenyl, 2- propenyl, 1- butenyl, 2- butenyl, 3- butenyl, 1- pentenyl, 2- pentenyl, 3- pentenyl, 4- pentenyl, 1- hexenyl, 2- hexenyl, 3- hexenyl, 4- hexenyl, 5-hexenyl, 1- methyl -2- propenyl, 2- methyl -2- propenyl, 1, 1- dimethyl -2- propenyl, 1, 2- dimethyl -2- propenyl, 1- ethyl -2- propenyl, 1- methyl -2- butenyl, 2- methyl -2- butenyl, 3- methyl -2- butenyl, 1- methyl -3- butenyl, 2- methyl -3- butenyl, 3- methyl -3- butenyl, 1, 1- dimethyl -2- butenyl, 1, 1- dimethyl -3- butenyl, 1, 2- dimethyl -2- butenyl, 1, 2- dimethyl -3- butenyl, 1, 3- dimethyl -2- butenyl, 1, 3- dimethyl -3- butenyl, 2, 3- dimethyl -2- butenyl, 2, 3- dimethyl -3- butenyl, 3, 3- dimethyl -2- butenyl, 1- ethyl -2- butenyl, 1- ethyl -3- butenyl, 2- ethyl -2- butenyl, 2- ethyl -3- butenyl, 1- methyl -2- pentenyl, 2- methyl -2- pentenyl, 3- methyl -2-

-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび 4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

[0099]

R<sup>c</sup> および Y' における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルオキシ、R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルフェニル、R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルフィニル、および R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルスルホニルで定義される、R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、ブロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-ブロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび 6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

[0100]

R<sup>c</sup> および Y' における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシカルボニルで定義される、

R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシとしては、

pentenyl, 4- methyl -2- pentenyl, 1- methyl -3- pentenyl, 2- methyl -3- pentenyl, 3- methyl -3- pentenyl, 4- methyl -3- pentenyl, 1- methyl -4- pentenyl, 2- methyl -4- pentenyl, 3- methyl -4- pentenyl, 4- methyl -4- pentenyl, 1, 1, 2- trimethyl -2- propenyl, 1- ethyl -1- methyl -2- propenyl, 2- chloro ethenyl, 2- bromo ethenyl, 2, 2- dichloro ethenyl, 3- chloro -2- propenyl, 3- fluoro -2- propenyl, 3- bromo -2- propenyl, 3- iodo -2- propenyl, 3, 3- dichloro -2- propenyl, 3, 3- difluoro -2- propenyl, 4- chloro -2- butenyl, 4, 4- dichloro -3- butenyl and 4 and 4 -difluoro -3- butenyl etc as alkenyl of straight chain or branched .

[0099]

With R<sup>b</sup> in R<sup>c</sup> and Y\* with optionally substitutable

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl oxy, R<sup>b</sup> with the optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl sulfenyl, R<sup>b</sup> with optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl sulfinyl, and R<sup>b</sup> it is defined with optionally substitutable C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl sulfonyl, as optionally substitutable

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl with R<sup>b</sup>, you can list ethynyl, 1- propynyl, 2- propynyl, 1- methyl -2- propynyl, 1, 1- dimethyl -2- propynyl, 1- methyl -1- ethyl -2- propynyl, 1- butynyl, 2- butynyl, 3- butynyl, 1- methyl -2- butynyl, 1- methyl -3- butynyl, 2- methyl -3- butynyl, 1, 1- dimethyl -2- butynyl, 1, 1- dimethyl -3- butynyl, 1, 2- dimethyl -3- butynyl, 2, 2- dimethyl -3- butynyl, 1- ethyl -2- butynyl, 1- ethyl -3- butynyl, 2- ethyl -3- butynyl, 1- pentynyl, 2- pentynyl, 3- pentynyl, 4- pentynyl, 1- methyl -3- pentynyl, 1- methyl -4- pentynyl, 2- methyl -3- pentynyl, 2- methyl -4- pentynyl, 3- methyl -4- pentynyl, 4- methyl -2- pentynyl, hexynyl, chloro ethynyl, bromo ethynyl, iodo ethynyl, 3- chloro -2- propynyl, 3- bromo -2- propynyl, 3- iodo -2- propynyl, 4- bromo -3- butynyl, 4- iodo -3- butynyl and 6- iodo -5- hexynyl etc as alkynyl of straight chain or branched .

[0100]

With R<sup>b</sup> in R<sup>c</sup> and Y\* it is defined with the optionally substitutable

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl,

With R<sup>b</sup> as optionally substitutable C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy,

直鎖または分岐状のアルコキシとしてメキシ、  
エトキシ、  
n-プロポキシ、  
i-プロポキシ、  
n-ブトキシ、  
i-ブトキシ、  
s-ブトキシ、  
t-ブトキシ、  
n-ペンチルオキシ、  
n-ヘキシルオキシ、  
1,1-ジメチルプロポキシ、  
1,2-ジメチルプロポキシ、  
2,2-ジメチルプロポキシ、  
1-エチルプロポキシ、  
1,1,2-トリメチルプロポキシ、  
1,2,2-トリメチルプロポキシ、  
1-エチル-1-メチルプロポキシ、  
1-エチル-2-メチルプロポキシ 1-メチルブトキシ、  
2-メチルブトキシ、  
3-メチルブトキシ、  
1-エチルブトキシ、  
2-エチルブトキシ、  
1,1-ジメチルブトキシ、  
1,2-ジメチルブトキシ、  
1,3-ジメチルブトキシ、  
2,2-ジメチルブトキシ、  
2,3-ジメチルブトキシ、  
3,3-ジメチルブトキシ、  
1-メチルペンチルオキシ、  
2-メチルペンチルオキシ、  
3-メチルペンチルオキシ、  
4-メチルペンチルオキシ、  
フルオロメトキシ、  
クロロメトキシ、  
ブロモメトキシ、

As alkoxy of straight chain or branched methoxy ,  
ethoxy ,  
n- propoxy ,  
i- propoxy ,  
n- butoxy ,  
i- butoxy ,  
s-butoxy ,  
t-butoxy ,  
n- pentyloxy ,  
n- hexyloxy ,  
1 and 1 -dimethyl propoxy ,  
1 and 2 -dimethyl propoxy ,  
2 and 2 -dimethyl propoxy ,  
1 -ethyl propoxy ,  
1, 1 and 2 -trimethyl propoxy ,  
1, 2 and 2 -trimethyl propoxy ,  
1 -ethyl -1- methyl propoxy ,  
1 -ethyl -2- methyl propoxy 1- methyl butoxy ,  
2 -methyl butoxy ,  
3 -methyl butoxy ,  
1 -ethyl butoxy ,  
2 -ethyl butoxy ,  
1 and 1 -dimethyl butoxy ,  
1 and 2 -dimethyl butoxy ,  
1.3 -dimethyl butoxy ,  
2 and 2 -dimethyl butoxy ,  
2 and 3 -dimethyl butoxy ,  
3 and 3 -dimethyl butoxy ,  
1 -methyl pentyloxy ,  
2 -methyl pentyloxy ,  
3 -methyl pentyloxy ,  
4 -methyl pentyloxy ,  
fluoro methoxy ,  
chloro methoxy ,  
bromo methoxy ,

ヨードメトキシ、	iodo methoxy ,
ジクロロメトキシ、	dichloro methoxy ,
トリクロロメトキシ、	trichloro methoxy ,
ジフルオロメトキシ、	difluoro methoxy ,
トリフルオロメトキシ、	trifluoromethoxy ,
クロロジフルオロメトキシ、	chloro difluoro methoxy ,
ブロモジフルオロメトキシ、	bromo difluoro methoxy ,
ジクロロフルオロメトキシ、	dichloro fluoro methoxy ,
1-クロロエトキシ、	1 -chloro ethoxy ,
1-ブロモエトキシ、	1 -bromo ethoxy ,
1-ヨードエトキシ、	1 -iodo ethoxy ,
1-フルオロエトキシ、	1 -fluoro ethoxy ,
2-クロロエトキシ、	2 -chloro ethoxy ,
2-ブロモエトキシ、	2 -bromo ethoxy ,
2-ヨードエトキシ、	2 -iodo ethoxy ,
2-フルオロエトキシ、	2 -fluoro ethoxy ,
2,2-ジフルオロエトキシ、	2 and 2 -difluoro ethoxy ,
2,2,2-トリフルオロエトキシ、	2, 2 and 2 -trifluoro ethoxy ,
2,2,2-トリクロロエトキシ、	2, 2 and 2 -trichloro ethoxy ,
ペンタフルオロエトキシ、	penta fluoro ethoxy ,
2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、	2, 2 and 2 -trifluoro -1- chloro ethoxy ,
1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、	1, 1, 2 and 2 -tetrafluoro ethoxy ,
3-ブロモプロポキシ、	3 -bromo propoxy ,
1-フルオロ-i-プロポキシ、	1 -fluoro -i- propoxy ,
1-クロロ-i-プロポキシ、	1 -chloro -i- propoxy ,
3-フルオロプロポキシ、	3 -fluoro propoxy ,
3-クロロプロポキシ、	3 -chloro propoxy ,
ヘプタフルオロプロポキシ、	heptafluoro propoxy ,
1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、	1, 1, 2, 2, 3 and 3 -hexafluoro propoxy ,
4-クロロブトキシ、	4 -chlorobutoxy ,
4-フルオロブトキシ、	4 -fluoro butoxy ,
5-クロロペンチルオキシ、	5 -chloro pentyloxy ,
5-フルオロペンチルオキシ、	5 -fluoro pentyloxy ,
6-クロロヘキシルオキシ、	6 -chloro hexyloxy ,
6-フルオロヘキシルオキシ、	6 -fluoro hexyloxy ,



ベンジルオキシ、

2-クロロベンジルオキシ、

3-ブロモベンジルオキシ、

4-クロロベンジルオキシ、

4-メチルベンジルオキシ、

4-t-ブチルベンジルオキシ、

2-メチルベンジルオキシ、

2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシおよび 6-(ピロール-1-イル)ヘキシルオキシ等が挙げられる。

[0101]

benzyloxy ,

2 -chloro benzyloxy ,

3 -bromo benzyloxy ,

4 -chloro benzyloxy ,

4 -methylbenzyl oxy ,

4 -t-butyl benzyloxy ,

2 -methylbenzyl oxy ,

2 -methoxy benzyloxy , 1- phenylethyl oxy , 1- (3 -chlorophenyl ) ethyl oxy , 2- phenylethyl oxy , 1- methyl -1- phenylethyl oxy , 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy , 1- (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy , 1- phenyl propyl oxy , 2- phenyl propyl oxy , 3- phenyl propyl oxy , 1- phenyl butyl oxy , 2- phenyl butyl oxy , 3- phenyl butyl oxy , 4- phenyl butyl oxy , 1- methyl -1- phenyl propyl oxy , 1- methyl -2- phenyl propyl oxy , 1- methyl -3- phenyl propyl oxy , 2- methyl -2- phenyl propyl oxy , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl oxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl oxy , 1- phenyl pentyloxy , 2- phenyl pentyloxy , 3- phenyl pentyloxy , 4- phenyl pentyloxy , 5-phenyl pentyloxy , 1- methyl -1- phenyl butyl oxy , 1- methyl -2- phenyl butyl oxy , 1- methyl -3- phenyl butyl oxy , 1- methyl -4- phenyl butyl oxy , 2- methyl -2- phenyl butyl oxy , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl oxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl oxy , 1- phenyl hexyloxy , 2- phenyl hexyloxy , 3- phenyl hexyloxy , 4- phenyl hexyloxy , 5-phenyl hexyloxy , 6-phenyl hexyloxy , 1- methyl -1- phenyl pentyloxy , 1- methyl -2- phenyl pentyloxy , 1- methyl -3- phenyl pentyloxy , 1- methyl -4- phenyl pentyloxy , 2- methyl -2- phenyl pentyloxy , 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyloxy , 2- methyl -2- you can list (3 -methylphenyl ) pentyloxy , pyridine -2- yl methyl oxy , 5-chloro thiophene -2- yl methyl oxy , 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl oxy , 2- (3 -methyl furan -2- yl ) ethyl oxy , 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl oxy , 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl oxy , 5- (1, 2 and 4 -triazole -1- yl ) pentyloxy and 6 - (pyrrole -1- yl ) hexyloxy etc.

[0101]

R<sup>c</sup>および Y' の定義における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> アルキルとしては、

直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、

エチル、

n-プロピル、

i-プロピル、

n-ブチル、

i-ブチル、

t-ブチル、

s-ブチル、

n-ペンチル、

n-ヘキシル、

n-ヘプチル、

n-オクチル、

n-ノニル、

n-デカニル、

2-エチルプロピル、

2,2-ジメチルプロピル、

1,2-ジメチルプロピル、

1,1,2-トリメチルプロピル、

1,2,2-トリメチルプロピル、

1-エチル-1-メチルプロピル、

1-エチル-2-メチルプロピル、

1-メチルブチル、

2-メチルブチル、

3-メチルブチル、

1,1-ジメチルブチル、

1,2-ジメチルブチル、

1,3-ジメチルブチル、

2,2-ジメチルブチル、

2,3-ジメチルブチル、

3,3-ジメチルブチル、

1-エチルブチル、

2-エチルブチル、

1-メチルペンチル、

With R<sup>b</sup> in defining R<sup>c</sup> and Y\* as optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> alkyl ,

As alkyl of straight chain or branched methyl ,

ethyl ,

n- propyl ,

i-propyl ,

n- butyl ,

i- butyl ,

t-butyl ,

s-butyl ,

n- pentyl ,

n- hexyl ,

n- heptyl ,

n- octyl ,

n- nonyl ,

n- decanyl ,

2 -ethyl propyl ,

2 and 2 -dimethyl propyl ,

1 and 2 -dimethyl propyl ,

1, 1 and 2 -trimethylpropyl ,

1, 2 and 2 -trimethylpropyl ,

1 -ethyl -1- methylpropyl ,

1 -ethyl -2- methylpropyl ,

1 -methyl butyl ,

2 -methyl butyl ,

3 -methyl butyl ,

1 and 1 -dimethylbutyl ,

1 and 2 -dimethylbutyl ,

1 and 3 -dimethylbutyl ,

2 and 2 -dimethylbutyl ,

2 and 3 -dimethylbutyl ,

3 and 3 -dimethylbutyl ,

1 -ethyl butyl ,

2 -ethyl butyl ,

1 -methyl pentyl ,

2-メチルペンチル、	2 -methyl pentyl ,
3-メチルペンチル、	3 -methyl pentyl ,
4-メチルペンチル、	4 -methyl pentyl ,
2-エチルヘキシル、	2 -ethylhexyl ,
フルオロメチル、	fluoromethyl ,
クロロメチル、	chloromethyl ,
ブロモメチル、	bromomethyl ,
ヨードメチル、	iodomethyl ,
ジフルオロメチル、	difluoromethyl ,
クロロジフルオロメチル、	chloro difluoromethyl ,
ブロモジフルオロメチル、	bromo difluoromethyl ,
トリフルオロメチル、	trifluoromethyl ,
ジクロロメチル、	dichloro methyl ,
トリクロロメチル、	trichloromethyl ,
1-クロロエチル、	1 -chloroethyl ,
1-ブロモエチル、	1 -bromoethyl ,
1-ヨードエチル、	1 -iodoethyl ,
1-フルオロエチル、	1 -fluoro ethyl ,
2-クロロエチル、	2 -chloroethyl ,
2-ブロモエチル、	2 -bromoethyl ,
2-ヨードエチル、	2 -iodoethyl ,
2-フルオロエチル、	2 -fluoro ethyl ,
2,2-ジフルオロエチル、	2 and 2 -difluoro ethyl ,
2,2,2-トリフルオロエチル、	2, 2 and 2 -trifluoroethyl ,
2,2,2-トリクロロエチル、	2, 2 and 2 -trichloroethyl ,
ペンタフルオロエチル、	pentafluoroethyl ,
2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、	2, 2 and 2 -trifluoro -1- chloroethyl ,
3-フルオロプロピル、	3 -fluoropropyl ,
3-クロロプロピル、	3 -chloropropyl ,
1-フルオロ-i-プロピル、	1 -fluoro -i-propyl ,
1-クロロ-i-プロピル、	1 -chloro -i-propyl ,
ヘプタフルオロプロピル、	heptafluoro propyl ,
1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、	1, 1, 2, 2, 3 and 3 -hexafluoropropyl ,
4-クロロブチル、	4 -chloro butyl ,
4-フルオロブチル、	4 -fluoro butyl ,

5-クロロペンチル、	5 -chloro pentyl ,
5-フルオロペンチル、	5 -fluoro pentyl ,
6-クロロヘキシル、	6 -chloro hexyl ,
6-フルオロヘキシル、	6 -fluoro hexyl ,
7-フルオロヘプチル、	7 -fluoro heptyl ,
8-クロロオクチル、	8 -chloro octyl ,
メキシメチル、	methoxymethyl ,
エトキシメチル、	ethoxymethyl ,
n-プロポキシメチル、	n- propoxy methyl ,
i-プロポキシメチル、	i- propoxy methyl ,
n-ブトキシメチル、	n- butoxy methyl ,
i-ブトキシメチル、	i- butoxy methyl ,
s-ブトキシメチル、	s-butoxy methyl ,
t-ブトキシメチル、	t-butoxy methyl ,
n-ペンチルオキシメチル、	n- pentyloxy methyl ,
2-メトキシエチル、	2 -methoxyethyl ,
3-エトキシプロピル、	3 -ethoxy propyl ,
3-メトキシプロピル、	3 -methoxypropyl ,
メチルチオメチル、	methylthio methyl ,
エチルチオメチル、	ethyl thio methyl ,
n-プロピルチオメチル、	n- propyl thio methyl ,
i-プロピルチオメチル、	i-propyl thio methyl ,
n-ブチルチオメチル、	n- butyl thio methyl ,
i-ブチルチオメチル、	i- butyl thio methyl ,
s-ブチルチオメチル、	s-butyl thio methyl ,
t-ブチルチオメチル、	t-butyl thio methyl ,
n-ペンチルチオメチル、	n- pentyl thio methyl ,
2-メチルチオエチル、	2 -methylthio ethyl ,
3-エチルチオプロピル、	3 -ethyl thio propyl ,
3-メチルチオプロピル、	3 -methylthio propyl ,
ベンジル、	benzyl ,
2-クロロベンジル、	2 -chloro benzyl ,
3-ブロモベンジル、	3 -bromo benzyl ,
4-クロロベンジル、	4 -chloro benzyl ,
4-メチルベンジル、	4 -methylbenzyl ,

4- <i>t</i> -ブチルベンジル、	4 - <i>t</i> -butyl benzyl ,
2-メチルベンジル、	2 -methylbenzyl ,
2-メトキシベンジル、	2 -methoxy benzyl ,
1-フェニルエチル、	1 -phenylethyl ,
1-(3-クロロフェニル)エチル、	1 - ( 3 -chlorophenyl ) ethyl ,
2-フェニルエチル、	2 -phenylethyl ,
1-メチル-1-フェニルエチル、	1 -methyl -1- phenylethyl ,
1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、	1 - ( 4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl ,
1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、	1 - ( 3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl ,
1-フェニルプロピル、	1 -phenyl propyl ,
2-フェニルプロピル、	2 -phenyl propyl ,
3-フェニルプロピル、	3 -phenyl propyl ,
1-フェニルブチル、	1 -phenyl butyl ,
2-フェニルブチル、	2 -phenyl butyl ,
3-フェニルブチル、	3 -phenyl butyl ,
4-フェニルブチル、	4 -phenyl butyl ,
1-メチル-1-フェニルプロピル、	1 -methyl -1- phenyl propyl ,
1-メチル-2-フェニルプロピル、	1 -methyl -2- phenyl propyl ,
1-メチル-3-フェニルプロピル、	1 -methyl -3- phenyl propyl ,
2-メチル-2-フェニルプロピル、	2 -methyl -2- phenyl propyl ,
2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、	2 - ( 4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl ,
2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、	2 -methyl -2- ( 3 -methylphenyl ) propyl ,
1-フェニルペンチル、	1 -phenyl pentyl ,
2-フェニルペンチル、	2 -phenyl pentyl ,
3-フェニルペンチル、	3 -phenyl pentyl ,
4-フェニルペンチル、	4 -phenyl pentyl ,
5-フェニルペンチル、	5 -phenyl pentyl ,
1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)	1 -methyl -1- phenyl butyl , 1- methyl -2- phenyl butyl , 1- methyl -3- phenyl butyl , 1- methyl -4- phenyl butyl , 2- methyl -2- phenyl butyl , 2- ( 4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl , 2- methyl -2- ( 3 -methylphenyl ) butyl , 1- phenyl hexyl , 2- phenyl hexyl , 3- phenyl hexyl , 4- phenyl hexyl , 5-phenyl hexyl , 6-phenyl hexyl , 1- methyl -1- phenyl pentyl , 1- methyl -2- phenyl pentyl , 1- methyl -3- phenyl pentyl , 1- methyl -4- phenyl pentyl , 2- methyl -2- phenyl pentyl , 2- ( 4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl pentyl , 2- methyl -2- ( 3 -methylphenyl ) pentyl , pyridine -2- yl methyl , 5-chloro thiophene -2- yl methyl , 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl , 2- ( 3 -methyl furan -2- yl ) ethyl , 3- ( 6

ペンチル、ピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、2,2-ジクロロシクロプロピルメチル、1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチル、テトラヒドロピラン-2-イルメチル、イミダゾール-1-イルメチル、2-ジフルオロメトキシエチル、2-メチルスルフェニルエチル、3-シアノプロピル、2-ホルミル-2-メチルプロピル、4-メトキシカルボニル-4-シアノブチル、5-(2-クロロフェニル)ペンチル、1-フェニル-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-エトキシメチル、1-(2-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-クロロメチル、1-フェニル-1,1-ジメトキシメチルおよび 6-ホルキノヘキシル等が挙げられる。

## 【0102】

R<sup>c</sup> および Y' の定義における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> アルケニルとしては、

直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、

1-プロペニル、  
2-プロペニル、  
1-ブテニル、  
2-ブテニル、  
3-ブテニル、  
1-ペンテニル、  
2-ペンテニル、  
3-ペンテニル、  
4-ペンテニル、  
1-ヘキセニル、  
2-ヘキセニル、  
3-ヘキセニル、

-trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl , 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl , 5- (1, 2 and 4 -triazole -1- yl ) pentyl , 6- (pyrrole -1- yl ) hexyl , cyclopropyl methyl , cyclobutyl methyl , cyclopentyl methyl , cyclohexyl methyl , 2, 2- dichloro cyclopropyl methyl , 1- phenylpyrazole -5-carboxymethyl , tetrahydropyran -2- yl methyl , imidazole -1- yl methyl , 2- difluoro methoxyethyl , 2- methyl sulfonyl ethyl , 3- cyanopropyl , 2- formyl -2- methylpropyl , 4- methoxycarbonyl -4- cyano butyl , 5- (2 -chlorophenyl ) pentyl , 1- phenyl -1- methoxymethyl , 1- phenyl -1- ethoxymethyl , 1- (2 -chlorophenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (3 -chlorophenyl ) -1 -methoxymethyl , 1- (4 -chlorophenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (2 -fluorophenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (3 -fluorophenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (4 -fluorophenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (2 -methylphenyl ) -1 -methoxymethyl , 1- (3 -methylphenyl ) - 1 -methoxymethyl , 1- (4 -methylphenyl ) - you can list 1 -methoxymethyl , 1- phenyl -1- chloromethyl , 1- phenyl -1, 1- dimethoxy methyl and 6 -morpholino hexyl etc.

## 【0102】

With R<sup>c</sup> in defining R<sup>b</sup> and Y' as optionally substitutable C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alkenyl ,

As alkenyl of straight chain or branched ethenyl ,

1-propenyl ,  
2-propenyl ,  
1-butenyl ,  
2-butenyl ,  
3-butenyl ,  
1-pentenyl ,  
2-pentenyl ,  
3-pentenyl ,  
4-pentenyl ,  
1-hexenyl ,  
2-hexenyl ,  
3-hexenyl ,

4-ヘキセニル、

5-ヘキセニル、

6-ヘプテニル、

7-オクテニル、

8-ノネニル、

9-デセニル、

1-メチル-2-プロペニル、

2-メチル-2-プロペニル、

1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニル、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、3-シアノ-2-プロペニル、4-(4-クロロフェニル)-4-エトキシカルボニル-3-ブテニル、3-(チアゾール-2-カルボニルオキシ)-4-メトキシ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、2-(4-クロロフェニル)エテニル、2-(3-クロロフェニル)エテニル、2-(2-クロロフェニル)エテニル、2-(4-フルオロフェニル)エテニル、2-(3-フルオロフェニル)エテニル、2-(2-フルオロフェニル)エテニル、2-(4-メチルフェニル)エテニル、2-(3-メチルフェニル)エテニル、2-(2-メチルフェニル)エテニル、2-フェニル-1,2-ジブロモエテニルおよび 6-(ピラゾール-1-イル)-3-ヘキセニル等が挙げられる。

[0103]

R<sup>c</sup>および Y' の定義における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> アルキニルとしては、直鎖また

4 -hexenyl ,

5 -hexenyl ,

6 -heptenyl ,

7 -octenyl ,

8 -nonenyl ,

9 -decenyl ,

1 -methyl -2- propenyl ,

2 -methyl -2- propenyl ,

1 and 1 -dimethyl -2- propenyl , 1, 2- dimethyl -2- propenyl , 1- ethyl -2- propenyl , 1- methyl -2- butenyl , 2- methyl -2- butenyl , 3- methyl -2- butenyl , 1- methyl -3- butenyl , 2- methyl -3- butenyl , 3- methyl -3- butenyl , 1, 1- dimethyl -2- butenyl , 1, 1- dimethyl -3- butenyl , 1, 2- dimethyl -2- butenyl , 1, 2- dimethyl -3- butenyl , 1, 3- dimethyl -2- butenyl , 1, 3- dimethyl -3- butenyl , 2, 3- dimethyl -2- butenyl , 2, 3- dimethyl -3- butenyl , 3, 3- dimethyl -2- butenyl , 1- ethyl -2- butenyl , 1- ethyl -3- butenyl , 2- ethyl -2- butenyl , 2- ethyl -3- butenyl , 1- methyl -2- pentenyl , 2- methyl -2- pentenyl , 3- methyl -2- pentenyl , 4- methyl -2- pentenyl , 1- methyl -3- pentenyl , 2- methyl -3- pentenyl , 3- methyl -3- pentenyl , 4- methyl -3- pentenyl , 1- methyl -4- pentenyl , 2- methyl -4- pentenyl , 3- methyl -4- pentenyl , 4- methyl -4- pentenyl , 1, 1, 2- trimethyl -2- propenyl , 1- ethyl -1- methyl -2- propenyl , 2- chloro ethenyl , 2- bromo ethenyl , 2, 2- dichloro ethenyl , 3- chloro -2- propenyl , 3- fluoro -2- propenyl , 3- bromo -2- propenyl , 3- iodo -2- propenyl , 3, 3- dichloro -2- propenyl , 3, 3- difluoro -2- propenyl , 4- chloro -2- butenyl , 4, 4- dichloro -3- butenyl , 4, 4- difluoro -3- butenyl 2- phenyl ethenyl , 3- cyano -2- propenyl , 4- (4 -chlorophenyl ) - 4 -ethoxy carbonyl -3- butenyl , 3- (thiazole -2- carbonyl oxy ) - 4 -methoxy -3- butenyl , 2- phenyl ethenyl , 2- (4 -chlorophenyl ) ethenyl , 2- (3 -chlorophenyl ) ethenyl , 2- (2 -chlorophenyl ) ethenyl , 2- (4 -fluorophenyl ) ethenyl , 2- (3 -fluorophenyl ) ethenyl , 2- (2 -fluorophenyl ) ethenyl , 2- (4 -methylphenyl ) ethenyl , 2- (3 -methylphenyl ) ethenyl , 2- (2 -methylphenyl ) ethenyl , 2- phenyl -1, 2- dibromo ethenyl and 6 - (pyrazole -1- yl )- you can list 3 -hexenyl etc.

[0103]

As optionally substitutable

C&lt;sub&gt;1&lt;/sub&gt;~C&lt;sub&gt;12&lt;/sub&gt;alkynyl with

は分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、ブロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-ブロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニル、6-ヨード-5-ヘキシニル、4-(2-クロロチアゾール-5-イル)-3-ブチニル、5-ホルミル-3-ペンチニル、6-メチルスルフェニル-5-ヘキシニル、2-フェニルエチニルおよび 3-シアノ-5-ヘキシニル等が挙げられる。

【0104】

R<sup>c</sup> および Y' の定義における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> アルコキシとしては、

直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、

エトキシ、

n-プロポキシ、

i-プロポキシ、

n-ブトキシ、

i-ブトキシ、

s-ブトキシ、

t-ブトキシ、

n-ペンチルオキシ、

n-ヘキシルオキシ、

1,1-ジメチルプロポキシ、

1,2-ジメチルプロポキシ、

2,2-ジメチルプロポキシ、

1-エチルプロポキシ、

1,1,2-トリメチルプロポキシ、

1,2,2-トリメチルプロポキシ、

1-エチル-1-メチルプロポキシ、

R<sup>b</sup> in defining R<sup>c</sup> and Y\*, the ethynyl, 1- propinyl, 2- propinyl, 1- methyl -2- propinyl, 1, 1- dimethyl -2- propinyl, 1- methyl -1- ethyl -2- propinyl, 1- butinyl, 2- butinyl, 3- butinyl, 1- methyl -2- butinyl, 1- methyl -3- butinyl, 2- methyl -3- butinyl, 1, 1- dimethyl -2- butinyl, 1, 1- dimethyl -3- butinyl, 1, 2- dimethyl -3- butinyl, 2, 2- dimethyl -3- butinyl, 1- ethyl -2- butinyl, 1- ethyl -3- butinyl, 2- ethyl -3- butinyl, 1- pentinyl, 2- pentinyl, 3- pentinyl, 4- pentinyl, 1- methyl -3- pentinyl, 1- methyl -4- pentinyl, 2- methyl -3- pentinyl, 2- methyl -4- pentinyl, 3- methyl -4- pentinyl, 4- methyl -2- pentinyl, hexinyl, chloro ethinyl, bromo ethinyl, iodo ethinyl, 3- chloro -2- propinyl, 3- bromo -2- propinyl, 3- iodo -2- propinyl, 4- bromo -3- butinyl, 4- iodo -3- butinyl, 6-iodo -5-hexinyl, 4- (2 -chloro thiazole -5-yl ) - you can list 3 -butinyl, 5-formyl -3- pentinyl, 6-methyl sulfenyl -5-hexinyl, 2- phenyl ethinyl and 3 -cyano -5-hexinyl etc as alkynyl of the straight chain or branched .

【0104】

With R<sup>b</sup> in defining R<sup>c</sup> and Y\* as optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>alkoxy ,

As alkoxy of straight chain or branched methoxy ,

ethoxy ,

n- propoxy ,

i- propoxy ,

n- butoxy ,

i- butoxy ,

s-butoxy ,

t-butoxy ,

n- pentyloxy ,

n- hexyloxy ,

1 and 1 -dimethyl propoxy ,

1 and 2 -dimethyl propoxy ,

2 and 2 -dimethyl propoxy ,

1 -ethyl propoxy ,

1, 1 and 2 -trimethyl propoxy ,

1, 2 and 2 -trimethyl propoxy ,

1 -ethyl -1- methyl propoxy ,



1-エチル-2-メチルプロポキシ、	1 -ethyl -2- methyl propoxy ,
1-メチルブトキシ、	1 -methyl butoxy ,
2-メチルブトキシ、	2 -methyl butoxy ,
3-メチルブトキシ、	3 -methyl butoxy ,
1-エチルブトキシ、	1 -ethyl butoxy ,
2-エチルブトキシ、	2 -ethyl butoxy ,
1,1-ジメチルブトキシ、	1 and 1 -dimethyl butoxy ,
1,2-ジメチルブトキシ、	1 and 2 -dimethyl butoxy ,
1,3-ジメチルブトキシ、	1.3 -dimethyl butoxy ,
2,2-ジメチルブトキシ、	2 and 2 -dimethyl butoxy ,
2,3-ジメチルブトキシ、	2 and 3 -dimethyl butoxy ,
3,3-ジメチルブトキシ、	3 and 3 -dimethyl butoxy ,
1-メチルペンチルオキシ、	1 -methyl pentyloxy ,
2-メチルペンチルオキシ、	2 -methyl pentyloxy ,
3-メチルペンチルオキシ、	3 -methyl pentyloxy ,
4-メチルペンチルオキシ、	4 -methyl pentyloxy ,
n-ヘプチルオキシ、	n- heptyl oxy ,
n-オクチルオキシ、	n- octyloxy ,
n-ノニルオキシ、	n- nonyl oxy ,
n-デカニルオキシ、	n- decanyl oxy ,
フルオロメトキシ、	fluoro methoxy ,
クロロメトキシ、	chloro methoxy ,
ブロモメトキシ、	bromo methoxy ,
ヨードメトキシ、	iodo methoxy ,
ジクロロメトキシ、	dichloro methoxy ,
トリクロロメトキシ、	trichloro methoxy ,
ジフルオロメトキシ、	difluoro methoxy ,
トリフルオロメトキシ、	trifluoromethoxy ,
クロロジフルオロメトキシ、	chloro difluoro methoxy ,
ブロモジフルオロメトキシ、	bromo difluoro methoxy ,
ジクロロフルオロメトキシ、	dichloro fluoro methoxy ,
1-クロロエトキシ、	1 -chloro ethoxy ,
1-ブロモエトキシ、	1 -bromo ethoxy ,
1-ヨードエトキシ、	1 -iodo ethoxy ,
1-フルオロエトキシ、	1 -fluoro ethoxy ,

2-クロロエトキシ、	2 -chloro ethoxy ,
2-ブロモエトキシ、	2 -bromo ethoxy ,
2-ヨードエトキシ、	2 -iodo ethoxy ,
2-フルオロエトキシ、	2 -fluoro ethoxy ,
2,2-ジフルオロエトキシ、	2 and 2 -difluoro ethoxy ,
2,2,2-トリフルオロエトキシ、	2, 2 and 2 -trifluoro ethoxy ,
2,2,2-トリクロロエトキシ、	2, 2 and 2 -trichloro ethoxy ,
ペンタフルオロエトキシ、	penta fluoro ethoxy ,
2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、	2, 2 and 2 -trifluoro -1- chloro ethoxy ,
1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、	1, 1, 2 and 2 -tetrafluoro ethoxy ,
3-ブロモプロポキシ、	3 -bromo propoxy ,
1-フルオロ-i-プロポキシ、	1 -fluoro -i- propoxy ,
1-クロロ-i-プロポキシ、	1 -chloro -i- propoxy ,
3-フルオロプロポキシ、	3 -fluoro propoxy ,
3-クロロプロポキシ、	3 -chloro propoxy ,
ヘプタフルオロプロポキシ、	heptafluoro propoxy ,
1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、	1, 1, 2, 2, 3 and 3 -hexafluoro propoxy ,
4-クロロブトキシ、	4 -chlorobutoxy ,
4-フルオロブトキシ、	4 -fluoro butoxy ,
5-クロロペンチルオキシ、	5 -chloro pentyloxy ,
5-フルオロペンチルオキシ、	5 -fluoro pentyloxy ,
6-クロロヘキシルオキシ、	6 -chloro hexyloxy ,
6-フルオロヘキシルオキシ、	6 -fluoro hexyloxy ,
ベンジルオキシ、	benzyloxy ,
2-クロロベンジルオキシ、	2 -chloro benzyloxy ,
3-ブロモベンジルオキシ、	3 -bromo benzyloxy ,
4-クロロベンジルオキシ、	4 -chloro benzyloxy ,
4-メチルベンジルオキシ、	4 -methylbenzyl oxy ,
4-t-ブチルベンジルオキシ、	4 -t-butyl benzyloxy ,
2-メチルベンジルオキシ、	2 -methylbenzyl oxy ,
2-メトキシベンジルオキシ、	2 -methoxy benzyloxy ,
1-フェニルエチルオキシ、	1 -phenylethyl oxy ,
1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、	1 - (3 -chlorophenyl ) ethyl oxy ,
2-フェニルエチルオキシ、	2 -phenylethyl oxy ,
1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、	1 -methyl -1- phenylethyl oxy ,

1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、  
 1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、  
 1-フェニルプロピルオキシ、  
 2-フェニルプロピルオキシ、  
 3-フェニルプロピルオキシ、  
 1-フェニルブチルオキシ、  
 2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、  
 4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、  
 1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、  
 2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、  
 2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、  
 5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、  
 1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、  
 2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、  
 2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、  
 2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、  
 4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、  
 6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、  
 1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、  
 1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、  
 2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、  
 ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、  
 1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、  
 2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、  
 3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、  
 4-(ピリジン-2-イル)ブチルオキシ、  
 5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシ、  
 6-(ピラゾール-1-イル)ヘキシルオキシ、  
 1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチルオキシ、  
 テトラヒドロピラン-2-イルメチルオキシ、  
 イミダゾール-1-イルメチルオキシ、  
 2-ジフルオロメチルエチルオキシ、  
 2-メチルスルフェニルエチルオキシ、  
 3-シアノプロピルオキシ、  
 2-ホルミル-2-メチルプロピルオキシ、  
 4-メトキシカルボニル-4-シアノブチルオキシ、  
 5-(2-クロロフェニル)ペンチルオキシおよび  
 6-モルホリノヘキシルオキシ等が挙げられる。

[0105]

R<sup>c</sup>および Y' の定義における R<sup>b</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシとし

1 - (4 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy ,  
 1 - (3 -chlorophenyl ) - 1 -methylethyl oxy ,  
 1 -phenyl propyl oxy ,  
 2 -phenyl propyl oxy ,  
 3 -phenyl propyl oxy ,  
 1 -phenyl butyl oxy ,  
 2 -phenyl butyl oxy , 3- phenyl butyl oxy , 4- phenyl butyl oxy ,  
 1- methyl -1- phenyl propyl oxy , 1- methyl -2- phenyl propyl oxy ,  
 1- methyl -3- phenyl propyl oxy , 2- methyl -2- phenyl propyl oxy ,  
 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methylpropyl oxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) propyl oxy ,  
 1- phenyl pentyloxy , 2- phenyl pentyloxy , 3- phenyl pentyloxy , 4- phenyl pentyloxy ,  
 5-phenyl pentyloxy , 1- methyl -1- phenyl butyl oxy , 1- methyl -2- phenyl butyl oxy ,  
 1- methyl -3- phenyl butyl oxy , 1- methyl -4- phenyl butyl oxy , 2- methyl -2- phenyl butyl oxy ,  
 2- (4 -chlorophenyl ) - 2 -methyl butyl oxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) butyl oxy ,  
 1- phenyl hexyloxy , 2- phenyl hexyloxy , 3- phenyl hexyloxy , 4- phenyl hexyloxy ,  
 5-phenyl hexyloxy , 6-phenyl hexyloxy , 1- methyl -1- phenyl pentyloxy ,  
 1- methyl -2- phenyl pentyloxy , 1- methyl -3- phenyl pentyloxy ,  
 1- methyl -4- phenyl pentyloxy , 2- methyl -2- phenyl pentyloxy ,  
 2- (4 -chlorophenyl ) - 2-methyl pentyloxy , 2- methyl -2- (3 -methylphenyl ) pentyloxy ,  
 pyridine -2- yl methyl oxy , 5-chloro thiophene -2- yl methyl oxy ,  
 1- methyl -3- chloro pyrazole -5-yl methyl oxy , 2- (3 -methyl furan -2- yl ) ethyl oxy ,  
 3- (6 -trifluoromethyl pyridine -2- yl ) propyl oxy , 4- (pyrimidine -2- yl ) butyl oxy ,  
 5- (triazole -1- yl ) pentyloxy , 6- (pyrrole -1- yl ) hexyloxy ,  
 1- phenylpyrazole -5-carboxymethyl oxy , tetrahydropyran -2- yl methyl oxy ,  
 imidazole -1- yl methyl oxy , 2- difluoro methoxyethyl oxy , 2- methyl sulfenyl ethyl oxy ,  
 3- cyanopropyl oxy , 2- formyl -2- methylpropyl oxy , 4- methoxycarbonyl -4- cyano butyl oxy ,  
 5- (2 -chlorophenyl ) pentyloxy and you can list 6 -morpholino hexyloxy etc.

[0105]

You can list methoxy methoxy , ethoxy methoxy , n- propoxy methoxy , i- propoxy methoxy , n- butoxy methoxy , i- butoxy

ては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、i-プロポキシメトキシ、n-ブトキシメトキシ、i-ブトキシメトキシ、s-ブトキシメトキシ、t-ブトキシメトキシ、n-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシ、3-メトキシプロポキシ、シアノメトキシメトキシ、2-(2-ニトロエトキシ)エトキシ、3-(1-メチルピラゾール-5-イルメトキシ)プロピルオキシ、4-(3-シアノ-2-メチルプロピルオキシ)ブトキシ、5-ベンジルオキシベンチルオキシおよび5-(2-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル)メトキシヘキシルオキシ等が挙げられる。

[0106]

Y の定義における、A<sup>1</sup> の同一炭素上に置換した2 個の Y により該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1 から3 個含んでいてもよい3 から7 員環としては、シクロプロピル、2,2-ジクロロシクロプロピル、シクロブチル、オキサタンおよびシクロペンチル等が挙げられる。

[0107]

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> の定義における、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> とが一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1 から4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい3 から7 員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンジイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

[0108]

U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> の定義における、U<sup>1</sup> および U<sup>2</sup> とが一緒になって形成する、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1 から4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい3 から7 員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンジイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

[0109]

A<sup>1</sup> としては、5 員環ヘテロ環および6 員環ヘテロ環等が挙げられ、好ましい A<sup>1</sup> としては、例えば、

[0110]

[化 17]

methoxy, s-butoxy methoxy, t-butoxy methoxy, n-pentyloxy methoxy, 2- methoxy ethoxy, 3- ethoxy propoxy, 3- methoxy propoxy, cyano methoxy methoxy, 2- (2 -nitro ethoxy ) ethoxy, 3- (1 -methyl pyrazole -5-yl methoxy ) propyl oxy, 4- (3 -cyano -2- methylpropyl oxy ) butoxy, 5-benzyloxy pentyloxy and 5 - (2 -trifluoromethyl thiazole -5-yl ) methoxy hexyloxy etc with R<sup>b</sup> in defining R<sup>c</sup> and Y\* as optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy .

[0106]

In defining Y, cyclopropyl, 2, 2- dichloro cyclopropyl, cyclobutyl, oxetane and cyclopentyl etc it is listed with Y of 2 it substitutes on same carbon of A<sup>1</sup> with said carbon atom oxygen atom, nitrogen atom or each 1 to 3 as 7 -member ring sulfur atom from 3 it is possible to include.

[0107]

In defining R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup>, R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> becoming simultaneous, you can list aziridine, morpholine, hexamethylene imine and 4 -benzyl piperazine etc 1 to 4 which is chosen from oxygen atom, nitrogen atom or sulfur atom as 7 -member ring from 3 may include the heteroatom .

[0108]

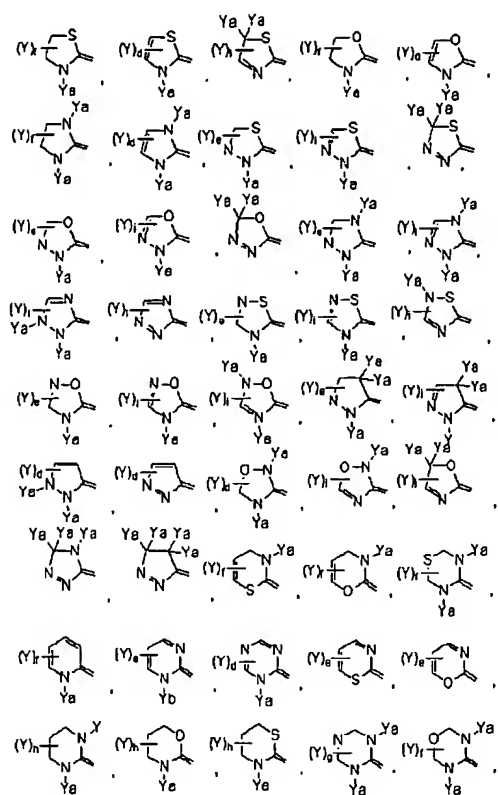
In defining U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup> becoming simultaneous, you can list aziridine, morpholine, hexamethylene imine and 4 -benzyl piperazine etc 1 to 4 which it forms, is chosen from oxygen atom, nitrogen atom or sulfur atom as 7 -member ring from 3 may include heteroatom .

[0109]

As A<sup>1</sup>, as A<sup>1</sup> to which you can list 5 -member ring heterocyclic ring and 6-member ring heterocyclic ring, etc is desirable, for example

[0110]

[Chemical Formula 17]

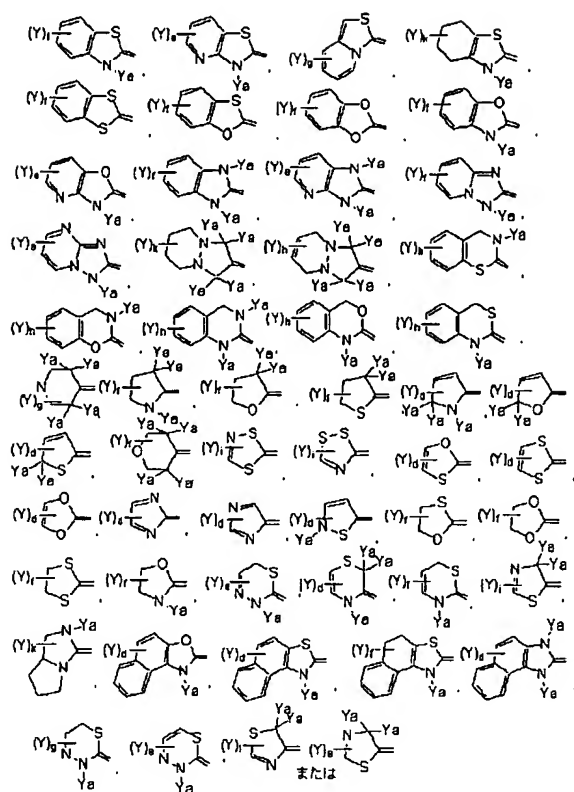


[0111]

【化 18】

[0111]

[Chemical Formula 18]

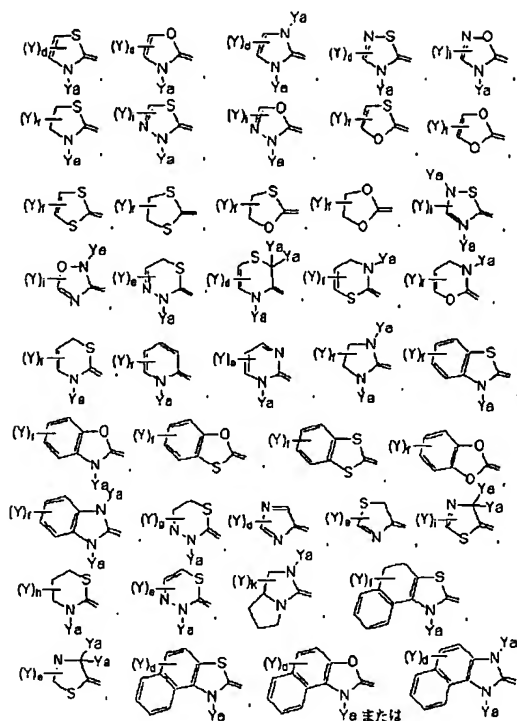


[0112]

To be listed, furthermore as desirable A<sup>1</sup>, for example

[0113]

[Chemical Formula 19]

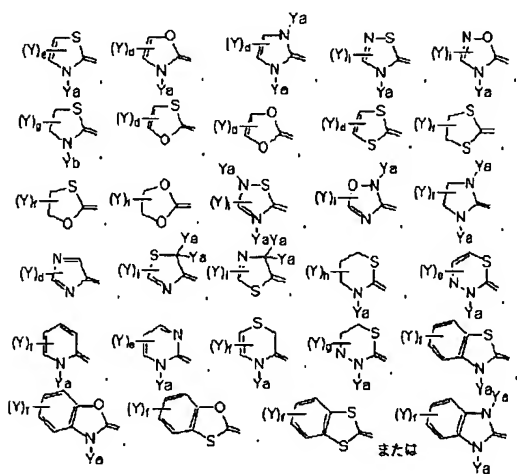


【0114】

が挙げられ、特に好ましい A<sup>1</sup>としては、例えば、

【0115】

【化 20】



【0116】

が挙げられる。

なお、Y、Ya、d、e、f、g、h、i、j および k は前記と

【0114】

As A<sup>1</sup> to which is listed, especially is desirable, for example

【0115】

【Chemical Formula 20】

【0116】

Is listed.

Furthermore, Y, Ya, d, e, f, g, h, i, j and k display meaning of

同様の意味を表す。

【0117】

A<sup>2</sup>としては、A<sup>2a</sup> から A<sup>2y</sup> が挙げられる。

【0118】

B としては、例えば、-CH<sub>2</sub>-、-C(=CH-OR<sup>4</sup>)-または -C(N=OR<sup>4</sup>)-が挙げられる。

【0119】

R<sup>1</sup>としては、好ましくは、例えば、水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、メチルが挙げられる。

【0120】

R<sup>2</sup>としては、好ましくは、例えば、水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、メチルが挙げられる。

【0121】

R<sup>3</sup>としては、好ましくは、例えば、水素原子、メチル、エチル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルおよび R<sup>a</sup> で置換されていてもよいベンジル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、水素原子、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルおよびメチルが挙げられる。

【0122】

R<sup>4</sup>としては、例えば、水素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、メチルが挙げられる。

【0123】

R<sup>5</sup>としては、例えば、水素原子、メチル、アセチル、フェニルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、メチルおよびアセチル等が挙げられる。

【0124】

R<sup>6</sup>としては、例えば、水素原子、塩素原子、メチル、エチル、メトキシカルボニル、メチルスルフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニルおよびベンジル等が挙げられる。

【0125】

R<sup>7</sup>としては、例えば、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されていてもよいヘテロアリ

beingsimilar to description above.

【0117】

As A<sup>2</sup>, you can list A<sup>2y</sup> from A<sup>2a</sup>.

【0118】

As B, for example -CH<sub>2</sub>-, -C(=CH-OR<sup>4</sup>)- (=CH-OR<sup>4</sup>) - or -C(N=OR<sup>4</sup>) - is listed.

【0119】

As R<sup>1</sup>, you can list preferably, for example hydrogen atom, methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, n-pentyl, 3-methyl butyl, n-hexyl and benzyl, etc can list the more preferably, for example methyl.

【0120】

As R<sup>2</sup>, you can list preferably, for example hydrogen atom, methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, n-pentyl, 3-methyl butyl, n-hexyl and benzyl, etc can list the more preferably, for example methyl.

【0121】

As R<sup>3</sup>, with preferably, for example hydrogen atom, methyl, ethyl, R<sup>a</sup> you can list optionally substitutable phenyl and optionally substitutable benzyl etc with R<sup>a</sup>, can list optionally substitutable phenyl and methyl with more preferably, for example hydrogen atom, R<sup>a</sup>.

【0122】

As R<sup>4</sup>, you can list for example hydrogen atom, methyl, ethyl and benzyl, etc can list the more preferably, for example methyl.

【0123】

As R<sup>5</sup>, you can list for example hydrogen atom, methyl, acetyl, phenyl and benzyl, etc can list the more preferably, for example methyl and acetyl etc.

【0124】

As R<sup>6</sup>, you can list optionally substitutable phenyl and benzyl etc with for example hydrogen atom, chlorine atom, methyl, ethyl, methoxycarbonyl, methyl sulphenyl, R<sup>a</sup>.

【0125】

As R<sup>7</sup>, with for example R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl, R<sup>a</sup> you can list



ール、水素原子、メチル、エチル、メトキシ、ベンジルオキシ、アセチルおよび R<sup>a</sup> で置換されているともよいベンジル等が挙げられる。

【0126】

R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> としては、例えば、水素原子、塩素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられる。

【0127】

R<sup>10</sup> としては、例えば、水素原子、塩素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

【0128】

R<sup>11</sup> としては、例えば、水素原子、メチルおよびエチル等が挙げられる。

【0129】

R<sup>12</sup> としては、例えば、水素原子およびメチル等が挙げられる。

【0130】

R<sup>13</sup> としては、例えば、水素原子、塩素原子、臭素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

【0131】

R<sup>a</sup> としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、CN、ニトロおよび C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、Cl、F、Br、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、エチル、プロピルおよびメチルが挙げられる。

【0132】

R<sup>b</sup> としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフェニル、R<sup>a</sup> で置換されているともよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されているともよいヘテロアリール、CN、ニトロおよび C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコシカルボニル等が挙げられる。

【0133】

R<sup>c</sup> としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、R<sup>a</sup> で置換されているともよいフェニル、R<sup>a</sup> で置換されているともよいヘテロアリール、R<sup>a</sup> で置換されているともよいフェニルカルボニル、R<sup>a</sup> で置換されているともよいフェニルスルホニル、R<sup>b</sup> で置換されているともよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル、R<sup>b</sup> で置換されているともよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル、R<sup>b</sup> で置換されている

optionally substitutable heteroaryl, hydrogen atom, methyl, ethyl, methoxy, benzyloxy, acetyl and optionally substitutable benzyl etc with R<sup>a</sup>.

【0126】

As R<sup>8</sup> and R<sup>9</sup>, you can list for example hydrogen atom, chlorine atom, methyl, ethyl and benzyl etc.

【0127】

As R<sup>10</sup>, you can list for example hydrogen atom, chlorine atom, methyl and methoxy etc.

【0128】

As R<sup>11</sup>, you can list for example hydrogen atom, methyl and ethyl etc.

【0129】

As R<sup>12</sup>, you can list for example hydrogen atom and methyl etc.

【0130】

As R<sup>13</sup>, you can list for example hydrogen atom, chlorine atom, bromine atom, methyl and methoxy etc.

【0131】

As R<sup>a</sup>, you can list preferably, for example halogen atom, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy, CN, nitro and C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl, etc can list the more preferably, for example Cl, F, Br, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, ethyl, propyl and methyl.

【0132】

As R<sup>b</sup>, with preferably, for example halogen atom, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl, R<sup>a</sup> you can list optionally substitutable heteroaryl, CN, nitro and C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy carbonyl etc with optionally substitutable phenyl, R<sup>a</sup>.

【0133】

As R<sup>c</sup>, with preferably, for example halogen atom, R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl, R<sup>a</sup> with optionally substitutable heteroaryl, R<sup>a</sup> with the optionally substitutable phenyl carbonyl, R<sup>a</sup> with optionally substitutable phenyl sulfonyl, R<sup>b</sup> with optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl,

てもよい  $C_2-C_6$  アルキニル、 $R^b$  で置換されていてもよい  $C_1-C_6$  アルコキシ、 $R^b$  で置換されていてもよい  $C_1-C_6$  アルキルスルフェニル、CN、ニトロ、OH、SH、SCN および  $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル等が挙げられる。

## 【0134】

$X^1$  としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、 $C_1-C_4$  アルキル、 $C_1-C_4$  アルコキシ、 $C_1-C_2$  ハロアルキル、 $C_1-C_2$  ハロアルコキシ、CN、ニトロ、S-R、 $NU^1U^2$ 、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび  $C_1-C_4$  アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、Cl、F、I、Br、メトキシ、エチル、n-プロピル、エトキシ、n-プロポキシ、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メトキシカルボニル、ペンタフルオロエチル、エトキシカルボニル、CN、アセチルおよびメチルが挙げられる。

## 【0135】

$X^2$  としては、好ましくは、例えば、 $C_1-C_4$  アルキルおよび  $R^a$  で置換されていてもよいフェニルが挙げられ、より好ましくは、例えば、メチルおよびフェニル等が挙げられる。

## 【0136】

$X^3$  としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、 $C_1-C_4$  アルキル、 $C_1-C_4$  アルコキシ、 $C_1-C_2$  ハロアルキル、 $C_1-C_2$  ハロアルコキシ、CN、ニトロ、S-R、 $NU^1U^2$ 、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび  $C_1-C_4$  アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、Cl、F、I、Br、メトキシ、エチル、n-プロピル、エトキシ、n-プロポキシ、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メトキシカルボニル、ペンタフルオロエチル、エトキシカルボニル、CN、アセチルおよびメチルが挙げられる。

## 【0137】

$X^4$  としては、好ましくは、例えば、ハロゲン原子、 $C_1-C_4$  アルキル、 $C_1-C_4$  アルコキシ、 $C_1-C_2$  ハロアルキル、 $C_1-C_2$  ハロアルコキシ、CN、ニトロ、S-R、 $NU^1U^2$ 、 $R^a$  で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび  $C_1-C_4$  アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、

$R^{<sup>b</sup>}$  with optionally substitutable  $C^{<sub>2</sub>}-C^{<sub>6</sub>}alkenyl$ ,  $R^{<sup>b</sup>}$  with optionally substitutable  $C^{<sub>2</sub>}-C^{<sub>6</sub>}alkynyl$ ,  $R^{<sup>b</sup>}$  you can list optionally substitutable  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>6</sub>}alkyl$  sulfonyl, CN, nitro, OH, SH, SCN and  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>6</sub>}alkoxy$  carbonyl etc with optionally substitutable  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>6</sub>}alkoxy$ ,  $R^{<sup>b</sup>}$ .

## 【0134】

As  $X^{<sup>1</sup>}$ , you can list optionally substitutable phenyl carbonyl and  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$  carbonyl etc with preferably, for example halogen atom,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkyl$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>2</sub>}haloalkyl$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>2</sub>}haloalkoxy$ , CN, nitro, S-R,  $NU^{<sup>1</sup>}U^{<sup>2</sup>}$ ,  $R^{<sup>a</sup>}$ , can list more preferably, for example Cl, F, I, Br, methoxy, ethyl, n-propyl, ethoxy, n-propoxy, chloro difluoromethyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, methoxycarbonyl, pentafluoroethyl, ethoxy carbonyl, CN, acetyl and methyl.

## 【0135】

As  $X^{<sup>2</sup>}$ , you can list optionally substitutable phenyl with preferably, for example  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkyl$ , and  $R^{<sup>a</sup>}$  can list more preferably, for example methyl and phenyl etc.

## 【0136】

As  $X^{<sup>3</sup>}$ , you can list optionally substitutable phenyl carbonyl and  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$  carbonyl etc with preferably, for example halogen atom,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkyl$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>2</sub>}haloalkyl$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>2</sub>}haloalkoxy$ , CN, nitro, S-R,  $NU^{<sup>1</sup>}U^{<sup>2</sup>}$ ,  $R^{<sup>a</sup>}$ , can list more preferably, for example Cl, F, I, Br, methoxy, ethyl, n-propyl, ethoxy, n-propoxy, chloro difluoromethyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, methoxycarbonyl, pentafluoroethyl, ethoxy carbonyl, CN, acetyl and methyl.

## 【0137】

As  $X^{<sup>4</sup>}$ , you can list optionally substitutable phenyl carbonyl and  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$  carbonyl etc with preferably, for example halogen atom,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkyl$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>4</sub>}alkoxy$ ,  $C^{<sub>1</sub>}-C^{<sub>2</sub>}haloalkyl$ ,

Cl, F, I, Br, メトキシ、エチル、n-プロピル、エトキシ、n-プロポキシ、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メトキシカルボニル、ペンタフルオロエチル、エトキシカルボニル、CN、アセチルおよびメチルが挙げられる。

## 【0138】

Y'としては、好ましくは、例えば、水素原子、ハロゲン原子、R<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、R<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェノキシ、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、R<sup>c</sup>で置換されていてもよいヘテロアリアル、CN、ニトロおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル等が挙げられる。

## 【0139】

U<sup>1</sup>およびU<sup>2</sup>としては、好ましくは、例えば、水素原子、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルカルボニルおよびC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、例えば、H、メチル、フェニル、ベンジル、アセチル、メトキシカルボニルが挙げられる。

## 【0140】

Dとしては、好ましくは、例えば、単結合、-C(=Q<sup>2</sup>)-および-C(R<sup>6</sup>)=N-O-が挙げられる。

## 【0141】

Zとしては、-OR<sup>1</sup>、-SR<sup>1</sup>および-NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>が挙げられる。

## 【0142】

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup>としては、好ましくは、=O、=S、=N-R<sup>7</sup>および=CH<sub>2</sub>である。

## 【0143】

Q<sup>4</sup>およびQ<sup>5</sup>としては、好ましくは、=Oおよび=Sである。

## 【0144】

Gとしては、例えば、G<sup>1</sup>、G<sup>2</sup>、G<sup>3</sup>、G<sup>4</sup>、G<sup>5</sup>、G<sup>6</sup>、G<sup>7</sup>およびG<sup>8</sup>が挙げられ、好ましくは、例えば、G<sup>1</sup>、G<sup>2</sup>、G<sup>3</sup>およびG<sup>4</sup>であり、さらに好ましくは、G<sup>1</sup>である。

C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub> haloalkoxy, CN, nitro, S-R, NU<sup>1</sup>U<sup>2</sup>, R<sup>a</sup>, can list more preferably, for example Cl, F, I, Br, methoxy, ethyl, n-propyl, ethoxy, n-propoxy, chloro difluoromethyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, methoxycarbonyl, pentafluoroethyl, ethoxycarbonyl, CN, acetyl and methyl.

## 【0138】

As Y\*, with preferably, for example hydrogen atom, halogen atom, R<sup>b</sup> with optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl, R<sup>b</sup> with optionally substitutable C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy, R<sup>c</sup> with the optionally substitutable phenyl, R<sup>c</sup> with optionally substitutable phenoxy, R<sup>c</sup> you can list optionally substitutable heteroaryl, CN, nitro and C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy carbonyl etc with the optionally substitutable phenyl C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl, R<sup>c</sup>.

## 【0139】

As U<sup>1</sup> and U<sup>2</sup>, you can list preferably, for example hydrogen atom, C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>alkyl, C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>haloalkyl, phenyl, heteroaryl, C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>alkyl carbonyl and C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>alkoxy carbonyl, etc can list more preferably, for example H, methyl, phenyl, benzyl, acetyl, methoxycarbonyl.

## 【0140】

As D, preferably, for example single bond, -C(=Q<sup>2</sup>) - and -C(R<sup>6</sup>)=N-O- you can list =N-O-.

## 【0141】

As Z, you can list -OR<sup>1</sup>, -SR<sup>1</sup> and -NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>.

## 【0142】

As Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, preferably, =O, =S, =N-R<sup>7</sup> and =CH<sub>2</sub> is.

## 【0143】

As Q<sup>4</sup> and Q<sup>5</sup>, preferably, =O and =S is.

## 【0144】

As G, you can list for example G<sup>1</sup>, G<sup>2</sup>, G<sup>3</sup>, G<sup>4</sup>, G<sup>5</sup>, G<sup>6</sup>, G<sup>7</sup> and G<sup>8</sup>.

および  $G^4$  であり、さらに好ましくは、 $G^1$  である。

【0145】

n は好ましくは 0、1 または 2 である。

【0146】

p は好ましくは 0 または 1 である。

【0147】

また、本願発明のヘテロ環イミノ芳香族化合物の農薬として許容される塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩、アンモニウム塩、イソプロピルアミン塩およびシュウ酸塩等が挙げられる。

【0148】

本発明化合物としては、互変異性によりイミノ結合が変化しないものが好ましい。

【0149】

次に、

本発明化合物の防除対象となる植物病害としては、

イネのいもち病(*Pyricularia oryzae*)、

ごま葉枯病(*Cochliobolus miyabeanus*)、

紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、

ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis* f.sp.hordei、f.sp.tritici)、

斑葉病(*Pyrenophora graminea*)、

網斑病(*Pyrenophora teres*)、

赤かび病(*Gibberella zeae*)、

さび病 (*Puccinia striiformis*、*P. graminis*、*P. recondita*、*P. hordei*)、

雪腐病(*Tipula* sp.、*Micronectria nivalis*)、

裸黒穂病(*Ustilago tritici*、*U. nuda*)、

アイスボット (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、

雲形病(*Rhynchosporium secalis*)、

葉枯病(*Septoria tritici*)、

ふ枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、

$G^{>8}$ , with preferably, for example  $G^{>1}$ ,  $G^{>2}$ ,  $G^{>3}$  and  $G^{>4}$ , furthermore it is a preferably,  $G^{>1}$ .

【0145】

n is preferably 0, 1 or 2.

【0146】

p is preferably 0 or 1 .

【0147】

In addition, you can list for example acetate, hydrobromide, hydroiodide, formate salt, acetate, ammonium salt, isopropyl amine salt and oxalate etc as acceptable salt as pesticide of heterocyclic ring imino aromatic compound of invention of this application .

【0148】

As the compound of this invention, those where imino bond does not change with tautomerism are desirable.

【0149】

Next,

As plant disease which becomes prevention object of the compound of this invention ,

rice blast of rice (*Pyricularia oryzae*),

*Cochliobolus miyabeanus* (*Cochliobolus miyabeanus*),

*Rhizoctonia solani* (*Rhizoctonia solani*),

powdery mildew of winter cereals (*Erysiphe graminis* f.sp.hordei, f.sp.tritici),

leaf stripe (*Pyrenophora graminea*),

net blotch (*Pyrenophora teres*),

*Fusarium* rot (*Gibberella zeae*),

rust (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*),

*Typhula* sp., *Micronectria nivalis* (*Tipula* sp., *Micronectria nivalis*),

*Ustilago tritici*, *Ustilago nuda* (*Ustilago tritici*, *U. nuda*),

ice pot (*Pseudocercospora herpotrichoides*),

*Rhynchosporium secalis* (scald) (*Rhynchosporium secalis*),

speckled leaf blotch of wheat & barley (*Septoria tritici*) (*Septoria tritici*),

glume blotch of wheat & barley (*Leptosphaeria nodorum*) (*Leptosphaeria nodorum*)

カンキツの黒点病(*Diaporthe citri*)、

そうか病(*Elsinoe fawcetti*)、

果実腐敗病(*Penicillium digitalum*, *P.italicum*)、

リンゴのモニリア病(*Sclerotinia mali*)、

腐らん病(*Valsa mali*)、

うどんこ病(*Podosphaera leucotricha*)、

斑点落葉病(*Alternaria mali*)、

黒星病(*Venturia inaequalis*)、

ナシの黒星病(*Venturia nashicola*)、

黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、

赤星病(*Gymnosporangium haraenum*)、

モモの灰星病(*Sclerotinia cinerea*)、

黒星病(*Cladosporium carpophilum*)、

フオモプシス腐敗病(*Phomopsis* sp.)、

ブドウのべと病(*Plasmopara viticola*)、

黒とう病(*Elsinoe ampelina*)、

晩腐病(*Glomerella cingulate*)、

うどんこ病(*Uncinula necator*)、

さび病(*Phakopsora ampelopsidis*)、

カキの炭そ病(*Gloeosporium kaki*)、

落葉病(*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella hawae*)、

ウリ類のべと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、炭そ病(*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病(*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病(*Mycosphaerella melonis*)、トマトの疫病(*Phytophthora infestans*)、輪紋病(*Alternaria solani*)、葉かび病(*Cladosporium fulvum*)、ナスの褐紋病(*Phomopsis vexans*)、うどんこ病(*Erysiphe cichoracoarum*)、アブラナ科野菜の黒斑病(*Alternaria japonica*)、白斑病(*Cercospora brassicae*)、ネギのさび病(*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病(*Cercospora kikuchii*)、黒とう病(*Elsinoe glycines*)、黒点病(*Diaporthe phaseololum*)、インゲンの炭そ病(*Colletotrichum lindemuthianum*)、ラッカセイの黒渋病(*Mycosphaerella personatum*)、褐斑病(*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病

*nodorum*) (*Leptosphaeria nodorum*),

melanose of Citrus spp., *Poncirus* spp., *fortunella* spp. (citrus) (*Diaporthe citri*),

scab (*Elsinoe fawcetti*),

*Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* (fruit spoilage disease) (*Penicillium digitalum*, *P.italicum*),

blossom blight of *Malus pumila* Miller var. *domestica* Schneider (apple) (*Sclerotinia mali*),

canker (*Valsa mali*),

powdery mildew (*Podosphaera leucotricha*),

*Alternaria* leaf spot (*Alternaria mali*),

scab (*Venturia inaequalis*),

scab of pear (*Venturia nashicola*),

Phoma rot (*Alternaria kikuchiana*),

rust (*Gymnosporangium haraenum*),

brown rot of *Prunus persica* Batsch. (*Sclerotinia cinerea*),

scab (*Cladosporium carpophilum*),

Phomopsis rot (*Phomopsis* sp.) (*Phomopsis* sp.),

downy mildew of grape (*Plasmopara viticola*),

*Elsinoe glycines* (anthracnose) (*Elsinoe ampelina*),

ripe rot (*Glomerella cingulate*),

powdery mildew (*Uncinula necator*),

rust (*Phakopsora ampelopsidis*),

anthracnose of persimmon (*Gloeosporium kaki*),

*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae* (leaf spot) (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella hawae*),

downy mildew of cucurbitaceous fruit (*Pseudoperonospora cubensis*), anthracnose (*Colletotrichum lagenarium*), powdery mildew (*Sphaerotheca fuliginea*), *Mycosphaerella melonis* (black rot) (*Mycosphaerella melonis*), *Phytophthora* rot of tomato (*Phytophthora infestans*), ring rot (*Alternaria solani*), *Cladosporium fulvum* (leaf mold) (*Cladosporium fulvum*), \* crest illness of eggplant (*Phomopsis vexans*), powdery mildew (*Erysiphe cichoracoarum*), Phoma rot of Brassicaceae vegetable (*Alternaria japonica*), white spot of brassica (*Cercospora brassicae*) (*Cercospora brassicae*), rust of onion (*Puccinia allii*), purple stain of soybean (*Cercospora kikuchii*) (*Cercospora kikuchii*), *Elsinoe glycines* (anthracnose) (*Elsinoe glycines*), melanose (*Diaporthe phaseololum*), anthracnose of kidney bean (*Colletotrichum lindemuthianum*), *Mycosphaerella personatum* of *Arachis*

(Erysiphe pisi)、ジャガイモの夏疫病(Alternaria solani)、イチゴのうどんこ病(Sphaerotheca humuli)、チャの網もち病(Exobasidium reticulatum)、白星病(Elsinoe leucospila)、タバコの赤星病(Alternaria lingipes)、うどんこ病(Erysiphe cichoracearum)、炭そ病(Colletotrichum tabacum)、テンサイの褐斑病(Cercospora beticola)、バラの黒星病(Diplocarpon rosae)、うどんこ病(Sphaerotheca pannosa)、キクの褐斑病(Septoria chrysanthemiindici)、白さび病(Puccinia horiana)、種々の作物の灰色かび病(Botrytis cinerea)、種々の作物の菌核病(Sclerotinia sclerotiorum)等が挙げられる。

## 【0150】

一方、本発明化合物は木乳類、魚類、甲殻類および益虫に対してほとんど悪影響がない極めて有用な化合物を含む。

## 【0151】

次に、前記(1)の G が  $G^1$  で  $A^2$  が  $A^2y$  でそれぞれ表される本発明化合物の製造法を以下に説明する。

(製造法)

## 【0152】

【化 21】

hypogaea L. (Mycosphaerella personatum), \* mottling illness (Cercospora arachidicola), powdery mildew of Pisum sativum L. (garden pea) (Erysiphe pisi), Alternaria solani of potato (Alternaria solani), powdery mildew of strawberry (Sphaerotheca humuli), Exobasidium reticulatum of Thea sinensis L. (tea) (Exobasidium reticulatum), Elsinoe leucospila (white star disease) (Elsinoe leucospila), rust of tobacco (Alternaria lingipes), powdery mildew (Erysiphe cichoracearum), anthracnose (Colletotrichum tabacum), \* mottling illness of Beta vulgaris L. var saccharifera Alef. (sugar beet) (Cercospora beticola), scab of Rosa (rose) (Diplocarpon rosae), powdery mildew (Sphaerotheca pannosa), \* mottling illness of Chrysanthemum morifolium Ramat. (chrysanthemum) (Septoria chrysanthemiindici), white rust (Puccinia horiana), gray mold of fruit of various crop (Botrytis cinerea), you can list Sclerotinia rot (Sclerotinia sclerotiorum) etc of various crop.

## 【0150】

On one hand, the compound of this invention for most part includes quite useful compound which does not have adverse effect vis-a-vis mammals, fish, shellfish and beneficial insect.

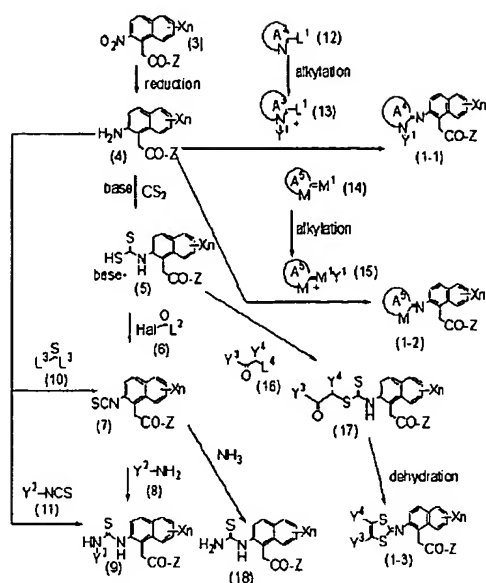
## 【0151】

Next, G of aforementioned (1) being  $G^{<sup>1</sup>}$ ,  $A^{<sup>2</sup>}$  being  $A^{<sup>2</sup>y}$ , production method of the compound of this invention which is displayed respectively is explained below.

(production method)

## 【0152】

[Chemical Formula 21]

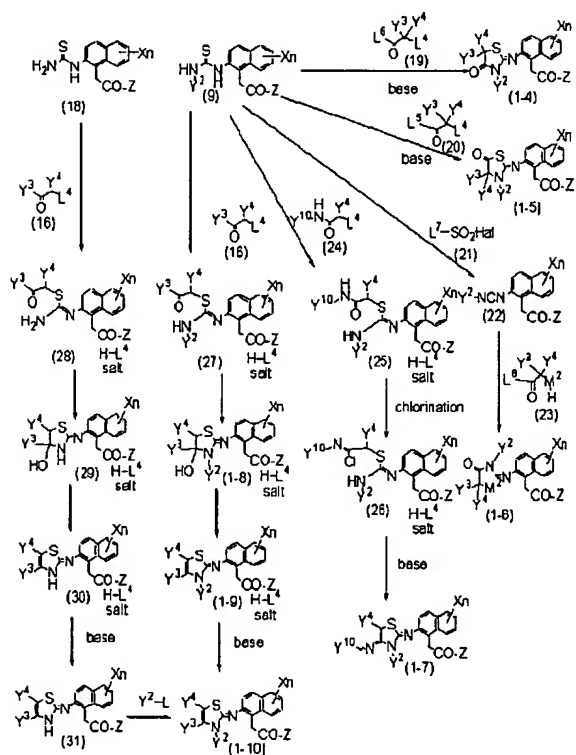


【0153】

【化 22】

[0153]

[Chemical Formula 22]

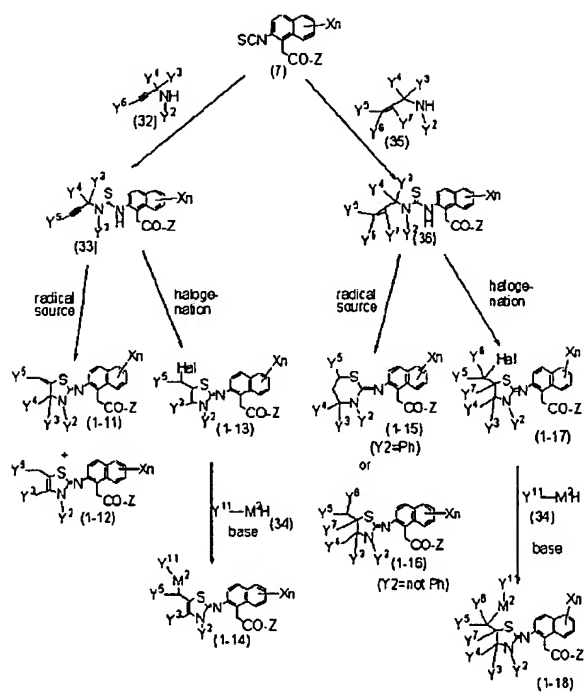


【0154】

【化 23】

[0154]

[Chemical Formula 23]

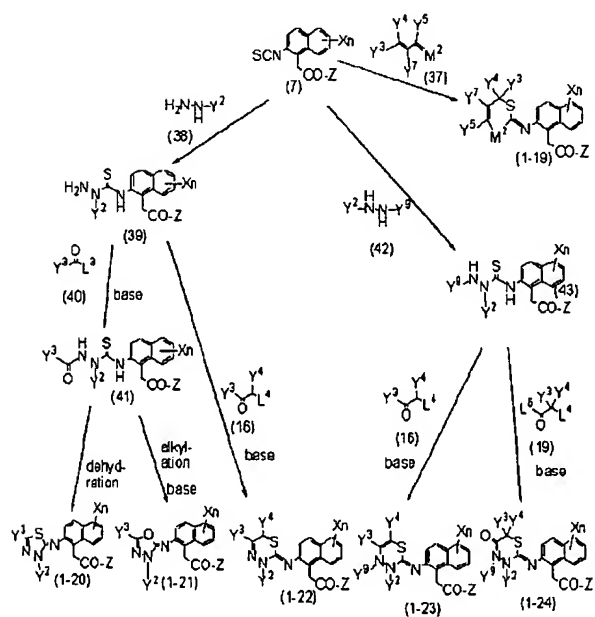


[0155]

[化 24]

[0155]

[Chemical Formula 24]



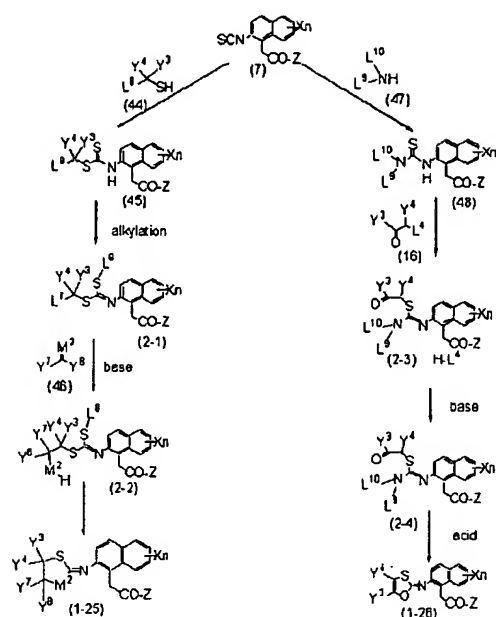
[0156]

[化 25]

[0156]

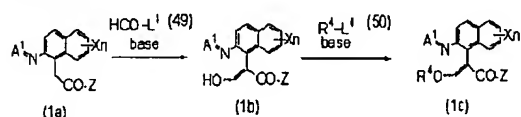
[Chemical Formula 25]





[0157]

[化 26]



[0158]

(A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>は、各々独立に、前記A<sup>1</sup>と同様の意味を表し、但し、窒素原子を脱離基L<sup>1</sup>またはイミノ結合のα位に有する環であり、A<sup>5</sup>は、前記A<sup>1</sup>と同様の意味を表し、但し、酸素原子、硫黄原子または窒素原子をC=M<sup>1</sup>またはイミノ結合のα位に有する環である。X、n、Z、R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>およびA<sup>2</sup>は前述と同じ意味を表す。L<sup>1</sup>は、良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1~4のアルコキシ、フェノキシ、炭素数1~4のアルキルアミノ、炭素数1~4のジアルキルアミノ、炭素数1~4のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L<sup>2</sup>およびL<sup>6</sup>は、良好な脱離基例えば、炭素数1~4のアルコキシ、炭素数1~4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1~4のアルキルアミノ、炭素数1~4のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L<sup>3</sup>は、各々独立に、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1~4のアルコキシ、炭素数1~4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1~4のアルキルアミノ、炭

[0157]

[Chemical Formula 26]

[0158]

(A<sup>3</sup> and A<sup>4</sup> in each independence, to display meaning of being similar to aforementioned A<sup>1</sup>, however, nitrogen atom withring which it possesses in the;al position of leaving group L<sup>1</sup> or imino bond, A<sup>5</sup> to display meaning of being similar to theaforementioned A<sup>1</sup>, however, oxygen atom, sulfur atom or nitrogen atom it is a ring which itpossesses in the;al position of C=M<sup>1</sup> or imino bond. X, n, Z, R<sup>4</sup>, A<sup>1</sup> and A<sup>2</sup> display same meaning as earlierdescription. L<sup>1</sup> alkyl sulfonyloxy, benzene sulfonyloxy, toluene sulfonyloxy, 1- pyrazolyl of dialkyl amino, carbon number 1~4 of alkyl amino, carbon number 1~4 of alkoxy, phenoxy, carbon number 1~4 of thesatisfactory leaving group for example fluorine atom, chlorine atom, bromine atom, iodine atom, carbon number 1~4 or is 1-imidazolyl etc. L<sup>2</sup> and L<sup>6</sup> dialkyl amino, 1- pyrazolyl of alkyl amino, carbon number 1~4 of alkyl thio, phenoxy, carbon number 1~4 of the alkoxy, carbon number 1~4 of satisfactory leaving group for example carbon number 1~4 or are 1-imidazolyl etc. L<sup>3</sup>, in each independence, dialkyl amino, 1- pyrazolyl of alkyl amino,

素数 1~4 のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L<sup>4</sup>は、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数 1~4 のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシまたはトルエンスルホニルオキシ等である。L<sup>5</sup>は、良好な脱離基例えば、塩素原子または臭素原子等である。L<sup>7</sup>は、炭素数 1~4 のアルキル基、フェニルまたはトリル基等である。L<sup>8</sup>は、水素原子、トリメチルシリル基、ターシャリーブチルジフェニルシリル基またはターシャリーブチルジフェニルシリル基等である。L<sup>9</sup>および L<sup>10</sup>は、各々独立に、Y と同じ意味を表すかまたは一緒になって、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-ピペリジニルまたはモルホリノを表す。Y<sup>1</sup>は、炭素数 1~6 のアルキル基または R<sup>a</sup> で置換されていてもよいベンジル基を表す。Y<sup>2</sup>、Y<sup>9</sup> および Y<sup>10</sup>は、各々独立に、Y と同じ意味を表す。Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup>、Y<sup>7</sup>、Y<sup>8</sup> および Y<sup>11</sup>は、各々独立に、水素原子かまたは、Y と同じ意味を表す。Y<sup>5</sup> および Y<sup>6</sup>は、各々独立に、水素原子、炭素数 1~6 のアルキル基または R<sup>a</sup> で置換されていてもよいフェニル基を表す。M は、酸素原子、硫黄原子または N-Y<sup>2</sup>を表す。M<sup>1</sup>は、酸素原子または硫黄原子を表す。M<sup>2</sup>は、酸素原子、硫黄原子または N-Y<sup>9</sup>を表す。Hal は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子またはフッ素原子を表す。R<sup>a</sup>は、前述と同じ意味を表す。)

出発物質である式(3)で表されるニトロナフチル酢酸化合物は、ヨーロッパ特許出願公報(EP-570817 号公報)、シンセシス(Synthesis)51 頁(1993 年)、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J.Org.Chem.)第 61 巻、5994 頁(1996 年)等に記載の公知の方法で製造できる。

ニトロナフチル酢酸化合物(3)から式(9)で表される化合物を製造する方法としては、ヨーロッパ特許出願公報(EP-447118 号公報)、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プリパレーションズ(Organic Functional Group Preparations)(Academic 社)第 1 巻、313 頁(1968 年)、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・ソサエティー(J.Am.Chem.Soc.)第 54 巻、781 頁(1932 年)、ケミカル・レビュー(Chem.Rev.)第 55 巻、181 頁(1955 年)等に記載の方法を用いることができる。

carbon number 1~4 of alkyl thio, phenoxy, carbon number 1~4 of alkoxy, carbon number 1~4 of satisfactory leaving group for example chlorine atom, bromine atom, iodine atom, carbon number 1~4 or is 1-imidazolyl etc. L<sup><sup>4</sup></sup> is alkyl sulfonyloxy, benzene sulfonyloxy or toluene sulfonyloxy etc of satisfactory leaving group for example chlorine atom, bromine atom, iodine atom, carbon number 1~4. L<sup><sup>5</sup></sup> is satisfactory leaving group for example chlorine atom or bromine atom etc. L<sup><sup>7</sup></sup> is alkyl group, phenyl or tolyl group etc of carbon number 1~4. L<sup><sup>8</sup></sup> is hydrogen atom, trimethylsilyl group, tertiary butyl dimethyl silyl group or tertiary butyl diphenylsilyl group etc. L<sup><sup>9</sup></sup> and L<sup><sup>10</sup></sup>, in each independence, display samemeaning, or as Y become simultaneous, 1-imidazolyl, 1-pyrazolyl, 1-bipyridinyl or display the morpholino. Y<sup><sup>1</sup></sup> displays optionally substitutable benzyl group with alkyl group or R<sup><sup>a</sup></sup> of carbon number 1~6. Y<sup><sup>2</sup></sup>, Y<sup><sup>9</sup></sup> and Y<sup><sup>10</sup></sup>, in each independence, display samemeaning as Y. Y<sup><sup>3</sup></sup>, Y<sup><sup>4</sup></sup>, Y<sup><sup>7</sup></sup>, Y<sup><sup>8</sup></sup> and Y<sup><sup>11</sup></sup>, in each independence, display samemeaning as hydrogen atom or Y. Y<sup><sup>5</sup></sup> and Y<sup><sup>6</sup></sup>, in each independence, display optionally substitutable phenyl group with alkyl group or R<sup><sup>a</sup></sup> of hydrogen atom, carbon number 1~6. M displays oxygen atom, sulfur atom or N-Y<sup><sup>2</sup></sup>. M<sup><sup>1</sup></sup> displays oxygen atom or sulfur atom. M<sup><sup>2</sup></sup> displays oxygen atom, sulfur atom or N-Y<sup><sup>9</sup></sup>. Hal displays chlorine atom, bromine atom, iodine atom or fluorine atom. R<sup><sup>a</sup></sup> displays same meaning as earlier description.)

European Patent Application disclosure (EP -570817disclosure), Synthesis (0039 - 7881, SYNTBF) (synthesis) 51 page (1993), it can produce nitro naphthylacetic acid compound which is displayed with Formula (3) which is a starting substance, with known method which is stated in Journal of Organic Chemistry (0022 - 3263, JOCEAH) (Journal of Organic Chemistry (0022 - 3263, JOCEAH)) Vol.61, 5994page (1996) etc.

European Patent Application disclosure (EP -447118disclosure), organic \* functional \* group \* [puripareishonzu] (organic Functional Group Preparations) (Academic corporation) Volume 1, 313page (1968), journal \* of \* the \* American \* chemical \* society (Journal of the American Chemical Society (0002 - 7863, JACSAT)) 5 th Vol.4, 781page (1932 years), method which is stated in chemical \* review (Chemical Reviews) Vol.55, 181page (1955 years) etc can be used as method which produces compound which from nitro naphthylacetic acid compound (3) isdisplayed with Formula (9).

すなわち、ニトロナフチル酢酸化合物(3)の還元反応によりアミノナフチル酢酸化合物(4)へと変換した後、塩基存在下、二硫化炭素と反応させることにより、ジチオカルバミン酸化合物(5)へと変換し、さらに、ジチオカルバミン酸化合物(5)を、式(6)で表される酸ハライド化合物と反応させることにより、イソチオシアネート化合物(7)へと変換した後、イソチオシアネート化合物(7)を式(8)で表されるアミン化合物と反応させることで、チオウレア化合物(9)を製造することが出来る。

このとき、アミン化合物として、アンモニアを用いることで、同様にチオウレア化合物(18)を製造することもできる。

また、イソチオシアネート化合物(7)は、アミノナフチル酢酸化合物(4)を式(10)で表されるチオカルボニル化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。

また、チオウレア化合物(9)はアミノナフチル酢酸化合物(4)と式(11)で表されるイソチオシアネート化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。

また、チオウレア化合物(9)は、シンセティック・コミュニケーション(Synth.Comm.)第25巻1号、43頁(1995年)に記載の方法を用いて、スルホン酸ハライド化合物(21)と反応させることにより、カルボジイミド化合物(22)へと変換することができる。

【0159】

本発明化合物(1-1)および(1-2)は、アミノナフチル酢酸化合物(4)を原料にアンゲバンテ・シェミー(Angew.Chem.)第80巻、799頁(1968年)に記載の方法あるいはその方法に準じて製造することが出来る。

すなわち本発明化合物(1-1)は、予め式(12)で表される化合物をアルキル化し式(13)で表されるアンモニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、アミノナフチル酢酸化合物(4)と反応させることにより製造できる。

同様に、本発明化合物(1-2)は、予め式(14)で表される化合物をアルキル化し式(15)で表されるオキシニウム塩またはチオオキシニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、アミノナフチル酢酸化合物(4)と反応させることにより製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例え

With reduction reaction of namely, nitro naphthylacetic acid compound (3) to amino naphthylacetic acid compound (4) after converting, under base existing, reacting with carbon disulfide after it converts to with the dithiocarbamic acid compound (5) by, furthermore, by reacting with acid halide compound which is displayed dithiocarbamic acid compound (5), with Formula (6), to isothiocyanate compound (7) converting, By fact that it reacts with amine compound which is displayed isothiocyanate compound (7) with Formula (8), it is possible to produce thiourea compound (9).

At time of this, as amine compound, by fact that ammonia is used, it is possible also to produce thiourea compound (18) in same way.

In addition, to produce even with method that reacts with thiocarbonyl compound which is displayed amino naphthylacetic acid compound (4) with Formula (10), it is possible the isothiocyanate compound (7).

In addition, to produce even with method that amino naphthylacetic acid compound (4) with reacts with isothiocyanate compound which is displayed with Formula (11), it is possible thiourea compound (9).

In addition, it can convert thiourea compound (9), to with carbodiimide compound (22) by reacting [shinsetiku] \*communication (Synthetic Communications (0039 - 7911, SYNCAV)) Vol. 25 1 number, making use of method which is stated in 43 page (1995), sulfonic acid halide compound (21) with.

【0159】

To produce amino naphthylacetic acid compound (4) [angebante] \* method which is stated in [shemii] (Angewandte Chemie) Vol.80, 799page (1968) or according to method in starting material it is possible the the compound of this invention (1 - 1) and (1 - 2).

Namely compound which is displayed beforehand with Formula (12) the alkylation it does the compound of this invention (1 - 1) and, those which are made ammonium salt which is displayed with Formula (13), in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can produce amino naphthylacetic acid compound (4) with by reacting.

In same way, compound which is displayed beforehand with the Formula (14) alkylation it does the compound of this invention (1 - 2) and, those which are made the oxonium salt or [chiokisoniumu] salt which is displayed with Formula (15), in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can produce amino naphthylacetic acid compound (4) with by reacting.

As solvent, if it should have been a inactivity in reaction, for

ば、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。

アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等が挙げられる。

触媒としては、例えば、酸化銀、トリフルオロメタンスルホン酸銀塩等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 300 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 168 時間の範囲が好ましい。

アルキル化剤の当量としては、(12)または(14)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(13)または(15)は(4)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### 【0160】

本発明化合物(1-3)は、ジチオカルバミン酸化合物(5)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによってジチオカルバミン酸エステル化合物(17)へと変換した後、さらに必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤と反応させることによって製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル

example dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , or these mixed solvent etc can list, preferably , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane etc can list.

As alkylation agent , you can list for example methyl iodide , ethyl iodide , benzyl bromide or other alkyl halide and dimethyl sulfate , diethyl sulfate , methyl trifluoromethanesulfonate ester or other sulfonic acid esters , trimethyl oxonium tetrafluoroborate , triethyl oxonium tetrafluoroborate or other trialkyl oxonium salt , etc can list the preferably , trimethyl oxonium tetrafluoroborate etc.

As catalyst , you can list for example silver oxide , silver trifluoromethane sulfonate salt etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 300 hours, range of 168 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of alkylation agent , from 0.5 be able to use in range of 50 equivalent (12) or vis-a-vis (14), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , (13) or from 0.5 be able to use (15) in range of 50 equivalent vis-a-vis (4), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### 【0160】

dithiocarbamic acid compound (5) with ketone compound which is displayed with Formula (16), in and when according to need solvent depending, under and when base existing depending, under catalyst existing by fact that it reacts to dithiocarbamic acid ester compound (17) after converting, furthermore in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it reacts with drying agent the compound of this invention (1 - 3), by fact that it can produce.

As solvent , if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile ,

類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。

また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(5)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(16)は(5)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

脱水剤の当量としては、(17)に対して、0.1 から 100 当量の範囲で用いることができ、1 から 50 当量の範囲が好ましい。

#### 【0161】

本発明化合物(1-4)は、チオウレア化合物(9)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレ

propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N-methyl pyrrolidone, N, N'-dimethylimidazolidinone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, dichloromethane, chloroform, 1, 2-dichloroethane etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributylamine, pyridine, N-methyl piperidine, 4-dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra-N-butyl ammonium bromide etc.

As drying agent, it can use concentrated sulfuric acid, dicyclohexyl carbodiimide, phosphorus pentachloride or phosphorous oxychloride etc.

In addition, it is possible also to use concentrated sulfuric acid as solvent.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (5), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (16) in range of 50 equivalent vis-a-vis (5), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of drying agent, from 0.1 be able to use in range of 100 equivalent vis-a-vis (17), range of 1 to 50 equivalent is desirable.

#### 【0161】

the compound of this invention (1 - 4), thiourea compound (9) with in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing can produce carbonyl compound which is displayed with Formula (19), by fact that it reacts.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons,

ン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(9)に対して、0.1 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(19)は(9)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0162】

本発明化合物(1-5)は、チオウレア化合物(9)と式(20)で表される酸ハロゲン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキ

dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, ethanol, tetrahydrofuran, chloroform, dimethylformamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.1 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (19) in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0162】

the compound of this invention (1 - 5), thiourea compound (9) with in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing can produce acid halogen compound which is displayed with type (20), by fact that it reacts.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water

サン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(9)に対して、0.1 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(20)は(9)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0163]

本発明化合物(1-6)は、カルボジイミド化合物(22)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物(23)と反応させることによって製造することができる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジ

or these mixed solvent etc can list, preferably , tetrahydrofuran , chloroform , dimethylformamide etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.1 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (20) in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0163]

carbodiimide compound (22) in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, the compound of this invention (1 - 6), by fact that it reacts under catalyst existing, the carbonyl compound (23) with it can produce.

As solvent , if it should have been a inactivity in reaction, for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino

メチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(22)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(23)は(22)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0164】

本発明化合物(1-7)は、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを反応させることにより得られる。

すなわち、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプソイドチオウレア化合物(25)へと変換できる。

さらに、プソイドチオウレア化合物(25)は、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤により処理することによって、イミドイルクロライド化合物(26)へと変換できる。

さらに(26)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、本発明化合物(1-7)へと変換できる。

また、(25)とハロゲン化剤との反応で、塩基を用いることにより、(26)を単離することなく、(1-7)を得ることもできる。

(9)から(25)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリ

pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (22), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (23) in range of 50 equivalent vis-a-vis (22), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0164]

the compound of this invention (1 - 7) thiourea compound (9) with is acquired amide compound which is displayed with type (24) by reacting.

namely, thiourea compound (9) with amide compound which is displayed with type (24) in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can convert to with pseudo thiourea compound (25) by fact that it reacts.

Furthermore, in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, by fact that it treats with halogenating agent , it can convert pseudo thiourea compound (25), to with imidoyl chloride compound (26).

Furthermore in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it can convert (26), to with the compound of this invention (1 - 7) by reacting.

In addition, (25) with with reaction with halogenating agent , it can also obtain (1 - 7) without isolating (26) by using base .

If it should have been a inactivity in reaction at time of reacting which obtains (25) from (9), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide ,



ル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(24)は(9)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

(25)から(26)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。

ハロゲン化剤としては、テトラクロロエタン/トリフェニルホスフィン、オキシ塩化リン、5 塩化リン、3 塩化リン、シュウ酸ジクロライド、塩素、N-クロロコハク酸イミド等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩素化剤の当量としては、(25)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, ethanol, tetrahydrofuran, chloroform, 1, 2- dichloroethane, ethylacetate, acetone, acetonitrile, dimethylformamide, water etc can list.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (24) in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it should have been an inactivity in reaction at time of reacting which obtains (26) from (25), as solvent, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methyl ethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone, N, N'-dimethylimidazolidinone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane etc can list.

As halogenating agent, you can list tetrachloroethane /triphenyl phosphine, phosphorous oxychloride, phosphorus pentachloride, 3chloride phosphorus, oxalic acid dichloride, chlorine, N- chloro succinic acid imide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of chlorination agent, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (25), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

(26)から(1-7)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(26)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0165]

本発明化合物(1-10)は、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを反応させることにより得られる。

すなわち、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプソイドチオウレア化合物(27)へと変換できる。

さらに、プソイドチオウレア化合物(27)は、必要に応じて溶媒中、酸あるいは塩基性触媒存在下、反応させることにより、ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)へと変換できる。

さらに(1-8)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-9)へと変換できる。

さらに、(1-9)は、必要に応じて溶媒中、塩基で

If it should have been an inactivity in reaction at time of reacting which obtains (1 - 7) from (26), as solvent, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone, N, N'-dimethylimidazolidinone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, as base, for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base you can use.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (26), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

[0165]

the compound of this invention (1 - 10) thiourea compound (9) with is acquired ketone compound which is displayed with Formula (16) by reacting.

namely, thiourea compound (9) with ketone compound which is displayed with Formula (16) in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can convert to with pseudo thiourea compound (27) by fact that it reacts.

Furthermore, it can convert pseudo thiourea compound (27), to with hydroxy thiazolidine compound (1 - 8) in the according to need solvent, under acid or basic catalyst existing, by reacting.

Furthermore in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it can convert (1 - 8), to with the compound of this invention (1 - 9) by treating with drying agent.

Furthermore, it can convert (1 - 9), to with free compound (1 -

処理することにより、遊離の化合物(1-10)へと変換できる。

また、(9)と(16)との反応で、長時間、あるいは加熱処理あるいは触媒を用いて処理することにより、(27)または(1-8)を単離することなく(1-9)を得ることもできる。

また、(9)と(16)との反応で、塩基を用いることにより、(27)または(1-8)または(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。

また、(1-8)と脱水剤との反応で、塩基を用いることにより、(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。

また、チオウレア化合物(18)から同様に得られるチアゾリン化合物(31)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤で処理することによっても得られる。

(9)から(1-8)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。

酸性触媒としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、フッ化水素酸、酢酸、テトラフルオロボロ酸等が挙げられる。

塩基性触媒としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で

10) in according to need solvent ,by treating with base .

In addition, (9) with (16) with with reaction, it can also obtain (1 - 9) without isolating (1 - 8) by treating making use of lengthy , or the heat treatment or catalyst , (27) or.

In addition, (9) with (16) with with reaction, it can also obtain (1 - 10) without isolating (1 - 9) by using base , (27) or (1 - 8) or.

In addition, (1 - 8) with with reaction with drying agent , it can also obtain (1 - 10) without isolating (1 - 9) by using base .

In addition, thiazoline compound (31 ) which is acquired in same way from the thiourea compound (18) in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing it is acquired by also fact that it treats with the alkylation agent .

If it should have been a inactivity in reaction at time of reacting which obtains (1 - 8) from (9), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , ethanol , tetrahydrofuran , chloroform , 1, 2- dichloroethane , ethylacetate , acetone , acetonitrile , dimethylformamide , water etc can list.

As acid catalyst , you can list hydrochloric acid , hydrobromic acid , hydroiodic acid , hydrofluoric acid , acetic acid , tetrafluoro boric acid etc.

As basic catalyst , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of

行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(16)は(9)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)から本発明化合物(1-9)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

脱水剤としては、メタンスルホニルクロライド、トルエンスルホニルクロライド、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。

また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。

また、トルエン、ベンゼン、キシレン等の溶媒を用いて、共沸脱水により反応させることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好

100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (16) in range of 50 equivalent vis-a-vis (9), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it should have been a inactivity in reaction at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 9) from hydroxy thiazolidine compound (1 - 8), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone , N, N'; -dimethylimidazolidinone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

In addition, it is possible also to use pyridine etc as solvent .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As drying agent , it can use methane sulfonyl chloride , toluene sulfonyl chloride , trifluoromethanesulfonic acid anhydride , concentrated sulfuric acid , dicyclohexyl carbodiimide , phosphorus pentachloride or phosphorous oxychloride etc.

In addition, it is possible also to use concentrated sulfuric acid as solvent .

In addition, it is possible also to react making use of toluene , benzene , xylene or other solvent , with azeotropic boiling dehydration .

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

ましい。

塩基の当量としては、(1-8)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

脱水剤の当量としては、(1-8)に対して、0.1 から 100 当量の範囲で用いることができ、1 から 50 当量の範囲が好ましい。

(1-9)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(1-9)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

(31)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド

100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 8), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

As equivalent of drying agent , from 0.1 be able to use in range of 100 equivalent vis-a-vis (1 - 8), range of 1 to 5 0equivalent is desirable.

If it should have been a inactivity in reaction at time of reacting which obtains (1 - 10) from (1 - 9), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone , N, N'; -dimethylimidazolidinone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, as base , for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base you can use.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 9), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

If it should have been a inactivity in reaction at time of reacting which obtains (1 - 10) from (31) , as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone , N, N'; -dimethylimidazolidinone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl

類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(31)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

アルキル化剤の当量としては、(31)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### [0166]

本発明化合物(1-11)および(1-12)は、以下のような方法により製造できる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(32)で表されるプロパルギルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式(33)で表されるプロパルギルチオウレア化合物へ変換できる。

さらに、(33)は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、(1-11)と(1-12)の混合物を得ることができる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロ

sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, as base, for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N-methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base you can use.

As alkylation agent, you can list for example methyl iodide, ethyl iodide, benzyl bromide or other alkyl halide and dimethyl sulfate, diethyl sulfate, methyl trifluoromethanesulfonate ester or other sulfonic acid esters, trimethyl oxonium tetrafluoroborate, triethyl oxonium tetrafluoroborate or other trialkyl oxonium salt, etc can list the preferably, methyl trifluoromethanesulfonate ester etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (31), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

As equivalent of alkylation agent, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (31), range of 20 equivalent is desirable from 0.1.

#### [0166]

It can produce the compound of this invention (1 - 11) and (1 - 12), like below with method.

namely, isothiocyanate compound (7) with in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, propargyl amine compound which is displayed with the type (32), to propargyl thiourea compound which by fact that it reacts is displayed with Formula (33) it can convert.

Furthermore, (33) (1 - 11) with can acquire mixture of (1 - 12) in the according to need solvent, by treating with radical generator.

As solvent, if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters,

ゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはテトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アゾビスイソブチロニトリル等が用いられる。

また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(7)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(32)は(7)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### [0167]

本発明化合物(1-13)は、前述のプロパルギルチオウレア化合物(33)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤で処理することにより製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロ

acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably tetrahydrofuran, chloroform, acetone, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As radical generator, it can use trifluoroacetic acid, oxygen, air, benzoyl peroxide, azobisisobutyronitrile etc.

In addition, it is possible also to use trifluoroacetic acid as solvent.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (32) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### [0167]

the compound of this invention (1 - 13), in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, can produce aforementioned propargyl thiourea compound (33) by treating with halogenating agent.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters,

ゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモコハク酸イミド、N-クロロコハク酸イミド、N-ヨードコハク酸イミド、テトラブチルアンモニウムトリブロマイド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(33)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

ハロゲン化剤の当量としては、(33)に対して 0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0168]

本発明化合物(1-14)は、前述の(1-13)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチキエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル

acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As halogenating agent, it can use iodine, bromine, N- bromo succinic acid imide, N- chloro succinic acid imide, N- iodo succinic acid imide, tetra butyl ammonium tri bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (33), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of halogenating agent, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (33), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0168]

the compound of this invention (1 - 14), in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, is acquired amine compound, alcohol compound or mercaptan compound which is displayed with aforementioned (1 - 13) with Formula (34) by reacting.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile,



類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(1-13)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(34)は(1-13)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0169】

本発明化合物(1-15)および(1-16)は、以下の様な方法により製造できる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(35)で表されるアリルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式(36)で表されるアリルチオウレア化合物へ変換できる。

さらに、(36)は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、Y<sup>2</sup> がフェニルの場合には本発明化合物(1-15)を、Y<sup>2</sup> がフェニル以外の場合には本発明化合物(1-16)をそれぞれ得ることができる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメ

propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, diazabicyclo undecene, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and cesium fluoride, potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 13), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (34) in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 13), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0169】

It can produce the compound of this invention (1 - 15) and (1 - 16), like below with method.

namely, isothiocyanate compound (7) with in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, allyl amine compound which is displayed with the Formula (35), to allyl thiourea compound which by fact that it reacts is displayed with Formula (36) it can convert.

Furthermore, (36) when Y<sup>2</sup> is phenyl in according to need solvent, by treating with radical generator, when the compound of this invention (1 - 15), Y<sup>2</sup> is other than phenyl, can acquire the compound of this invention (1 - 16) respectively.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers,

キシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アゾビスイソブチロニトリル等が用いられる。

また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(7)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(35)は(7)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### 【0170】

本発明化合物(1-17)は、前述のアリルチオウレア化合物(36)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤で処理することにより製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメ

benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, chloroform, acetone, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As radical generator, it can use trifluoroacetic acid, oxygen, air, benzoyl peroxide, azobisisobutyronitrile etc.

In addition, it is possible also to use trifluoroacetic acid as solvent.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (35) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### 【0170】

the compound of this invention (1 - 17), in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, can produce aforementioned allyl thiourea compound (36) by treating with halogenating agent.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers,

キシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモこはく酸イミド、N-クロロこはく酸イミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(36)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

ハロゲン化剤の当量としては、(36)に対して 0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0171]

本発明化合物(1-18)は、前述の(1-17)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメ

benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As halogenating agent, it can use iodine, bromine, N- bromo succinic acid imide, N- chloro succinic acid imide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (36), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of halogenating agent, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (36), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0171]

the compound of this invention (1 - 18), in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, is acquired amine compound, alcohol compound or mercaptan compound which is displayed with aforementioned (1 - 17) with Formula (34) by reacting.

As solvent, if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other

タン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(1-17)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(34)は(1-17)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0172】

本発明化合物(1-19)は、シンセシス(Synthesis)896 頁(1981 年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(37)で表されるオレフィン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル

halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, diazabicyclo undecene, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and cesium fluoride, potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra-N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 17), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (34) in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 - 17), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0172】

It can produce the compound of this invention (1 - 19), Synthesis (0039 - 7881, SYNTBF) (synthesis) method which is stated in 896 page (1981) or according to method.

namely, isothiocyanate compound (7) with in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it is acquired olefin compound which is displayed with Formula (37) by reacting.

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile,

類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。

塩基の当量としては、(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(37)は(7)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0173】

本発明化合物(1-20)は、西ドイツ特許出願公報 (DE-3025559 号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(38)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(39)へ変換できる。

さらに式(40)で表されるカルボニル化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては、触媒存在下、反応させることで、アシルチオセミカルバジド化合物(41)へと変換することができる。

さらに、アシルチオセミカルバジド化合物(41)を必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-20)を得ることができる。

イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(39)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタ

propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile etc can list.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (37) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0173】

It can produce the compound of this invention (1 - 20), method which is stated in West German Patent application disclosure (DE-3025559 disclosure) or according to method.

namely, isothiocyanate compound (7) with in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can convert hydrazine compound which is displayed with Formula (38) to thiosemicarbazide compound (39) by reacting.

Furthermore in carbonyl compound and according to need solvent which are displayed with the type (40), under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, by fact that it reacts, it can convert to with acyl thiosemicarbazide compound (41).

Furthermore, acyl thiosemicarbazide compound (41) in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, it can acquire the compound of this invention (1 - 20) by treating with drying agent.

If it should have been an inactivity in reaction from isothiocyanate compound (7), at the time of reacting which obtains thiosemicarbazide compound (39), as solvent, for

ノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(38)は(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

チオセミカルバジド化合物(39)からアシルチオセミカルバジド化合物(41)へ変換する反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム

example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetone, acetonitrile, dimethylformamide etc can list.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of substrate, from 0.01 be able to use (38) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it should have been a inactivity in reaction from thiosemicarbazide compound (39) is converted at time of reacting which, as solvent to acyl thiosemicarbazide compound (41), for example diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetone, acetonitrile, dimethylacetamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, diazabicyclo undecene, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and cesium fluoride, potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic

ム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(39)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(40)は(39)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

アシルチオセミカルバジド化合物(41)から、本発明化合物(1-20)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ベンゼン、キシレン、クロロホルム等が挙げられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、5 塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。

また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

脱水剤の当量としては、脱水剤は(41)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることがで

base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (39), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of substrate , from 0.01 be able to use (40) in range of 50 equivalent vis-a-vis (39), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it should have been a inactivity in reaction, as solvent from the acyl thiosemicarbazide compound (41), at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 20), the for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably , benzene , xylene , chloroform etc can list.

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As drying agent , it can use concentrated sulfuric acid , dicyclohexyl carbodiimide , phosphorus pentachloride or phosphorous oxychloride etc.

In addition, it is possible also to use concentrated sulfuric acid as solvent .

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of drying agent , from 0.01 be able to use drying agent in range of 50 equivalent vis-a-vis (41), range of

き、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0174】

本発明化合物(1-21)は、西ドイツ特許出願公報 (DE-3025559 号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。

すなわち前述のアシルチオセミカルバジド化合物(41)を、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤と反応させることによって、得ることができる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチキセタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。

アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

アルキル化剤の当量としては、アルキル化剤は(41)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0175】

本発明化合物(1-22)は、前述のチオセミカルバ

1 to 20 equivalent is desirable.

【0174】

It can produce the compound of this invention (1 - 21), method which is stated in West German Patent application disclosure (DE-3025559disclosure ) or according to method .

Namely in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing by fact that it reacts with alkylation agent , it canacquire aforementioned acyl thiosemicarbazide compound (41).

As solvent , if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide orwater or these mixed solvent etc can list, preferably , ethanol , tetrahydrofuran , chloroform , 1, 2- dichloroethane , dimethylacetamide etc can list.

As alkylation agent , for example methyl iodide , ethyl iodide , benzyl bromide or other alkyl halide and dimethyl sulfate , diethyl sulfate , methyl trifluoromethanesulfonate ester or other sulfonic acid esters , trimethyl oxonium tetrafluoroborate , triethyl oxonium tetrafluoroborate or other trialkyl oxonium salt etc are listed.

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours,range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of alkylation agent , from 0.01 be able to use alkylation agent in rangeof 50 equivalent vis-a-vis (41), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0175】

the compound of this invention (1 - 22), aforementioned



ジド化合物(39)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって得られる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキササン、シクロヘキササン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(39)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(16)は(39)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0176】

本発明化合物(1-23)は、イソチオシアネート化合物(7)と式(42)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(43)へ変換した後、さらに必要に応じて溶

thiosemicarbazide compound (39) with in according to need solvent , under andwhen according to need base existing depending, under catalyst existing, it reacts the ketone compound which is displayed with Formula (16), by fact that isacquired.

As solvent , if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide orwater or these mixed solvent etc can list, preferably , ethanol , tetrahydrofuran , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetone , acetonitrile , dimethylformamide etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours,range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (39), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (16)in range of 50 equivalent vis-a-vis (39), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

【0176】

the compound of this invention (1 - 23), isothiocyanate compound (7) with hydrazine compound which is displayed with thetype (42) in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, byreacting, after converting to thiosemicarbazide compound (43), furthermore

媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(16)で表されるケトン化合物と反応させることによって得られる。

イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(43)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトニトリル等が挙げられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(42)は(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

チオセミカルバジド化合物(43)から本発明化合物(1-23)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、クロロホルム、ジメチルアセトア

in according to need solvent ,under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it reacts with ketone compound which is displayed with Formula (16) by factthat is acquired.

If it should have been a inactivity in reaction from isothiocyanate compound (7), at the time of reacting which obtains thiosemicarbazide compound (43), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably , ethanol , tetrahydrofuran , chloroform , acetonitrile etc can list.

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of substrate , from 0.01 be able to use (42) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it should have been a inactivity in reaction, as solvent at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 23) from thiosemicarbazide compound (43), for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , tetrahydrofuran , benzene , xylene , chloroform , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone etc can list.

ミド、N-メチルピロリドン等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(43)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(16)は(43)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

【0177】

本発明化合物(1-24)は前述のチオセミカルバジド化合物(43)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキササン、シクロヘキサンの脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (43), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (16) in range of 50 equivalent vis-a-vis (43), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0177]

Aforementioned thiosemicarbazide compound (43) with carbonyl compound which is displayed with the Formula (19) in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing it can produce the compound of this invention (1 - 24) by fact that it reacts.

As solvent , if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , ethanol , tetrahydrofuran , chloroform , dimethylformamide etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium

化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(43)に対して、0.1 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(19)は(43)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### 【0178】

本発明化合物(1-25)はヘテロサイクルス(Heterocycles)第 50 巻、195 頁(1999 年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(44)で表されるメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、ジチオカルバミン酸エステル化合物(45)とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アルキル化剤で処理することにより、ジチオアセタール化合物(2-1)へと変換できる。

さらにジチオアセタール化合物(2-1)と式(46)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより(2-2)および(1-25)の混合物が得られる。

また、(7)から(2-1)の反応では、(45)を単離することなく(2-1)を得ることもできる。

また、(2-1)から(1-25)の反応では、長時間あるいは、加熱することにより(2-2)を単離することなく(1-25)を得ることもできる。

また、単離した(2-2)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させるかまたは加熱処理することにより、(1-25)へ変換することもできる。

(7)から(2-1)への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチ

hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.1 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (43), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (19) in range of 50 equivalent vis-a-vis (43), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### [0178]

It can produce the compound of this invention (1 - 25) method which is stated in [heterosaikurusu ] (Heterocycles (0385 - 5414) ) Vol.50 , 195page (1999 ) or according to method .

namely, isothiocyanate compound (7) with mercaptan compound which is displayed with type (44) in the according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, by reacting, dithiocarbamic acid ester compound (45) with after doing, in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it can convert to with dithio acetal compound (2 - 1) by treating with alkylation agent .

Furthermore dithio acetal compound (2 - 1) with in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, (2 - 2) and mixture of (1 - 25) is acquired carbonyl compound which is displayed with Formula (46) by reacting.

In addition, with reaction of (2 - 1), it can also obtain (2 - 1) from (7) without isolating (45).

In addition, with reaction of (1 - 25), it can also obtain (1 - 25) from (2 - 1) without isolating (2 - 2) lengthy or, by heating.

In addition, in according to need solvent , under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it reacts, or it is possible also fact that it converts to (1 - 25) by heat treatment doing, (2 - 2) which is isolated.

At time of reacting to (2 - 1), as solvent from (7), if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether ,

ルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキシニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキシニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキシニウム塩等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、(45)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(44)は(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

またアルキル化剤は(45)に対して、0.01 から 50

tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, toluene, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetone, acetonitrile, dimethylacetamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, diazabicyclo undecene, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As alkylation agent, for example methyl iodide, ethyl iodide, benzyl bromide or other alkyl halide and dimethyl sulfate, diethyl sulfate, methyl trifluoromethanesulfonate ester or other sulfonic acid esters, trimethyl oxonium tetrafluoroborate, triethyl oxonium tetrafluoroborate or other trialkyl oxonium salt etc are listed.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis(45), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of substrate, from 0.01 be able to use (44) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition from 0.01 be able to use alkylation agent in range

当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

(2-1)から(1-25)への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、キシレン、トルエン等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(2-1)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(46)は(2-1)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### 【0179】

本発明化合物(1-26)は、特開昭 55-108869 およびケミストリー・レターズ(Chemistry Letters)1705 頁(1988 年)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造できる。

すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(47)で表されるアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させるこ

of 50 equivalent vis-a-vis (45), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

At time of reacting to (1 - 25), as solvent from (2 - 1), if it should have been a inactivity in reaction, for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, xylene, toluene etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, diazabicyclo undecene, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and cesium fluoride, potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.01 be able to use in range of 50 equivalent vis-a-vis (2 - 1), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of substrate, from 0.01 be able to use (46) in range of 50 equivalent vis-a-vis (2 - 1), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### 【0179】

It can produce the compound of this invention (1 - 26), Japan Unexamined Patent Publication Showa 55-108869 and Chemistry Letters (0366 - 7022, CMLTAG) (Chemistry Letters (0366 - 7022, CMLTAG)) method which is stated in 1705 page (1988) or according to method.

namely, isothiocyanate compound (7) with in and when according to need solvent depending, under catalyst existing, by fact that it reacts amine compound which is displayed with

とによって、チオウレア化合物(48)へ変換できる。

さらに、チオウレア化合物(48)は、式(16)で表されるケトン化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによりプソイドチオウレア化合物(2-3)へと変換できる、さらに(2-3)は、必要に応じて溶媒中、塩基で処理することにより遊離の化合物(2-4)に変換できる。

さらに、(2-4)は、必要に応じて溶媒中、酸で処理することにより、本発明化合物(1-26)に変換できる。

また、チオウレア化合物(48)とケトン類(16)との反応で、塩基を過剰に用いることにより、(2-3)を単離することなく、(2-4)を得ることもできる。

また、チオウレア化合物(48)とケトン類(16)との反応で、長時間あるいは、加熱処理することにより、(2-3)および(2-4)を単離することなく(1-26)を得ることもできる。

イソチオシアネート化合物(7)から、チオウレア化合物(48)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(47)は(7)に対して、0.01 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

Formula (47), to thiourea compound (48), it can convert.

Furthermore, as for thiourea compound (48), in ketone compound and according to need solvent which are displayed with Formula (16), under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it can convert to with pseudo thiourea compound (2 - 3) by reacting, furthermore it can convert (2 - 3), to free compound (2 - 4) in according to need solvent , by treating with base .

Furthermore, it can convert (2 - 4), to the compound of this invention (1 - 26) in according to need solvent , by treating with acid .

In addition, thiourea compound (48) with ketones (16) with reaction, it can also obtain (2 - 4) without isolating (2 - 3) by using base for the excess .

In addition, thiourea compound (48) with ketones (16) with reaction, it can also obtain (1 - 26) without isolating (2 - 4) lengthy or by heat treatment doing, (2 - 3) or.

If it should have been an inactivity in reaction from isothiocyanate compound (7), at the time of reacting which obtains thiourea compound (48), as solvent , for example methanol , ethanol or other lower alcohols , diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methyl ethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or dimethyl sulfoxide or these mixed solvent etc can list, preferably , tetrahydrofuran , chloroform , 1, 2- dichloroethane , ethylacetate , acetonitrile , dimethylacetamide etc can list.

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of substrate , from 0.01 be able to use (47) in range of 50 equivalent vis-a-vis (7), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

チオウレア化合物(48)から本発明化合物(1-26)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(48)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(16)は(48)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### [0180]

本発明化合物(1a)は、式(49)で表されるギ酸ハライド化合物、ギ酸エステル化合物またはギ酸アミド化合物と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより本発明化合物(1b)に変換できる。

さらに(1b)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(50)で表されるアルキルハライドまたはアルキ

If it should have been an inactivity in reaction, as solvent at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 26) from thiourea compound (48), for example methanol, ethanol or other lower alcohols, diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetone, acetonitrile, dimethylformamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (48), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (16) in range of 50 equivalent vis-a-vis (48), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### [0180]

In formic acid halide compound, formic acid ester compound or formic acid amide compound and solvent which are displayed with the type (49), under and when base existing depending, under catalyst existing, it can convert the compound of this invention (1 a), to the compound of this invention (1 b) by reacting.

Furthermore in according to need solvent, under and when according to need base existing depending, under catalyst existing, it can convert (1 b), to the compound of this



ル硫酸エステル等と反応させることにより、本発明化合物(1c)に変換できる。

また、(1a)から(1b)への反応では、塩基を過剰に用いて、(1b)を単離せずに直接(1c)を合成することもできる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(1a)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(49)は(1a)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0181]

(1)の G が式 G<sup>2</sup> から G<sup>14</sup> で表される化合物は、原料となるナフチル酢酸化合物の代わりに、ニトロナフタレンのオルト位に式 G<sup>2</sup> から G<sup>14</sup> で表される基が置換した化合物を出発原料として用いることにより同様に製造できる。

invention (1 c) by reacting with alkyl halide or alkyl sulfate ester etc which is displayed with the type (50).

In addition, with reaction to (1 b), using base for excess, without isolating (1 b) is possible also fact that directly it synthesizes (1 c) from (1 a).

As solvent, if it should have been an inactivity in reaction, for example diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2-dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N-methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, xylene, toluene, dichloromethane, chloroform, 1, 2-dichloroethane, acetonitrile, dimethylformamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N-methyl piperidine, 4-dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra-N-butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (1 a), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (49) in range of 50 equivalent vis-a-vis (1 a), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0181]

In place of naphthylacetic acid compound which becomes starting material, it can produce the compound where G of (1) from type G<sup>2</sup> is displayed with G<sup>14</sup>, in same way compound which group which in the ortho position of nitro naphthalene from type

ることにより同様に製造できる。

[0182]

ニトロナフタレンのオルト位に  $G^2$ ,  $G^5$ ,  $G^6$  または  $G^7$  で表される基が置換した化合物は、例えば国際出願公開 WO96/26191、国際出願公開 WO96/36615 あるいは特開平 9-104676 号公報記載の方法を参考に、 $G^3$  または  $G^9$  で表される基が置換した化合物は、例えば WO99/20615 記載の方法を参考に、 $G^4$  が置換した化合物は、例えば国際出願公開 WO96/36229 記載の方法を参考に、 $G^{10}$  が置換した化合物は、例えばドイツ特許 19756115 記載の方法を参考に、 $G^{11}$ ,  $G^{12}$  または  $G^{14}$  が置換した化合物は、例えば特開平 11-335361 号公報記載の方法を参考に、 $G^{13}$  が置換した化合物は、例えば特開平 11-220050 号公報、特開平 7-179450 号公報等記載の方法を参考に、それぞれ製造することができる。

また、(1)の  $A^2$  が式  $A^2a$  から  $A^2d$ 、 $A^2h$  から  $A^2m$ 、 $A^2o$  から  $A^2q$  で表または  $A^2v$  から  $A^2w$  される化合物は、原料として、ナフタレン環の代わりに相当するヘテロ環を有する化合物を用いることにより同様に製造できる。

また、 $A^2$  が式  $A^2e$  または  $A^2f$  で表される化合物は、原料として、アミノナフチル酢酸化合物の代わりに相当するアミノピラゾール-N-酢酸化合物を用いることにより同様に製造できる。

原料となるアミノピラゾール-N-酢酸化合物は以下の方法により製造できる。

[0183]

[化 27]

$G^{2/}$  is displayed with  $G^{14/}$  substitutes as starting material by using.

[0182]

As for compound which group which in ortho position of nitro naphthalene is displayed with  $G^{2/}$ ,  $G^{5/}$ ,  $G^{6/}$  or  $G^{7/}$  substitutes, method which is stated in for example International Patent Publication WO 96/26191, International Patent Publication WO 96/36615 or Japan Unexamined Patent Publication Hei 9-104676 disclosure in reference, as for compound which group which is displayed with  $G^{3/}$  or  $G^{9/}$  substitutes, method which is stated in for example WO 99/20615 in reference, as for compound which  $G^{4/}$  substitutes, method which is stated in for example International Patent Publication WO 96/36229 in reference, As for compound which  $G^{10/}$  substitutes, method which is stated in for example German Patent 19756115 in reference, as for compound which  $G^{11/}$ ,  $G^{12/}$  or  $G^{14/}$  substitutes, method which is stated in for example Japan Unexamined Patent Publication Hei 11-335361 disclosure in reference, as for compound which  $G^{13/}$  substitutes, method which is stated in for example Japan Unexamined Patent Publication Hei 11-220050 disclosure, Japan Unexamined Patent Publication Hei 7-179450 disclosure etc can be produced in reference, respectively.

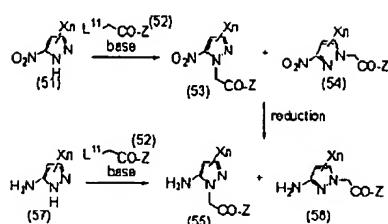
In addition,  $A^{2/}$  of (1) from type  $A^{2/a}$  from  $A^{2/d}$ ,  $A^{2/h}$  from  $A^{2/m}$ ,  $A^{2/o}$  with  $A^{2/q}$  can produce compound which  $A^{2/w}$  is done, in same way from chart or  $A^{2/v}$  by using compound which possesses heterocyclic ring which is suitable in place of naphthalene ring as starting material.

In addition, it can produce compound where  $A^{2/}$  is displayed with type  $A^{2/e}$  or  $A^{2/f}$ , in same way by using amino pyrazole -N- acetic acid conversion compound which is suitable in place of amino naphthylacetic acid compound as starting material.

It can produce amino pyrazole -N- acetic acid conversion compound which becomes starting material with method below.

[0183]

[Chemical Formula 27]



[0184]

(X, n および Z は、前述と同じ意味を表し、L<sup>11</sup> は良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数 1~4 のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシまたはトルエンスルホニルオキシ等である。)

ニトロピラゾール-N-酢酸化合物(53)および(54)は、式(52)で表されるハロ酢酸化合物等と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ニトロピラゾール化合物(51)と反応させることにより製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好

[0184]

(X, n and Z display same meaning as earlier description, L<sup>11</sup> is alkyl sulfonyloxy, benzene sulfonyloxy or toluene sulfonyloxy etc of the satisfactory leaving group for example chlorine atom, bromine atom, iodine atom, carbon number 1~4.)

haloacetic acid compound etc which is displayed with type (52) and in solvent, under and when base existing depending, under catalyst existing, it can produce nitro pyrazole -N- acetic acid conversion compound (53) and (54), nitro pyrazole compound (51) with by reacting.

As solvent, if it should have been a inactivity in reaction, for example diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2-dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or other ketones, acetonitrile, propionitrile or other nitriles, dimethylformamide, dimethylacetamide, N- methyl pyrrolidone or other amides, pentane, hexane, cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons, dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably, tetrahydrofuran, benzene, xylene, toluene, dichloromethane, chloroform, 1, 2- dichloroethane, acetonitrile, dimethylformamide etc can list.

As base, it can use for example triethylamine, tributyl amine, pyridine, N- methyl piperidine, 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate, sodium carbonate, sodium hydrogen carbonate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium hydride or other inorganic base.

As catalyst, it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature, - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent, range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

ましい。

塩基の当量としては、(51)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(52)は(51)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

得られた(53)および(54)の混合物は、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

また、分離せずに次の反応に用いることもできる。

(53)から(55)または(54)から(56)へは、上述の、ニトロナフチル酢酸化合物(3)から、アミノナフチル化合物(4)を製造する方法に準じて同様に製造できる。

また、(53)と(54)とを分離せずに(55)および(56)の混合物を得た後、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することもできる。

#### [0185]

ニトロピラゾール化合物(51)は、例えばジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J.Org.Chem.)第38巻、1777頁(1973年)記載の方法で製造することができる。

#### [0186]

また、アミノピラゾール-N-酢酸化合物(55)および(56)は、式(52)で表されるハロ酢酸化合物等と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミノピラゾール化合物(57)と反応させることにより製造できる。

溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメチルキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセ

100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (51), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (52) in range of 50 equivalent vis-a-vis (51), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

Acquired (53) and mixture of (54) separation and purification is possible with the purification method of recrystallization , column chromatography or other option .

In addition, without separating it is possible also to use for the following reaction.

From (53) (55) or from (54) to (56), it can produce in sameway from above-mentioned, nitro naphthylacetic acid compound (3), according to method which produces amino naphthyl compound (4).

In addition, (53) with without separating (54) (55) and after acquiring mixture of (56), separation and purification it is possible also with purification method of recrystallization , column chromatography or other option to do.

#### [0185]

It can produce nitro pyrazole compound (51), with method which is stated in the for example Journal of Organic Chemistry (0022 - 3263, JOCEAH ) (Journal of Organic Chemistry (0022 - 3263, JOCEAH ) ) Vol.38 , 1777page (1973 ).

#### [0186]

In addition, haloacetic acid compound etc which is displayed with type (52) and in solvent , under and when base existing depending, under catalyst existing, it can produce amino pyrazole -N- acetic acid conversion compound (55) and (56), amino pyrazole compound (57) with byreacting.

As solvent , if it should have been a inactivity in reaction, for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , tetrahydrofuran , benzene , xylene , toluene , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetonitrile , dimethylformamide etc can list.

トニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(57)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(52)は(57)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

得られた(55)および(56)の混合物は、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

また、分離せずに次の反応に用いることもできる。

【0187】

また、 $A^2$  が式  $A^2g$  で表される化合物は、原料として相当するアミノピラゾール-N-酢酸化合物を用いることにより同様に製造できる。

【0188】

さらに、 $A^2$  が式  $A^2r$ 、 $A^2s$ 、 $A^2t$  または  $A^2u$  で表される化合物についても、同様に N-酢酸化合物を経由して製造することができる。

【0189】

また、前記(1)の  $A^1$  がオキシチオレン環またはジチオレン環でそれぞれ表される本発明化合物は以下のような方法によっても製造することができる。

【0190】

【化 28】

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent vis-a-vis (57), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (52) in range of 50 equivalent vis-a-vis (57), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

Acquired (55) and mixture of (56) separation and purification is possible with the purification method of recrystallization , column chromatography or other option .

In addition, without separating it is possible also to use for the following reaction.

【0187】

In addition,  $A^{2g}$  being type  $A^{2g}$ , it can produce compound which is displayed, in same way by using amino pyrazole -N- acetic acid conversion compound which is suitable as starting material .

【0188】

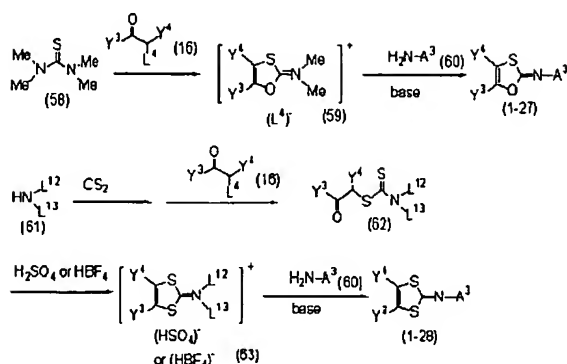
Furthermore, concerning compound where  $A^{2r}$  is displayed with type  $A^{2r}$ ,  $A^{2s}$ ,  $A^{2t}$  or  $A^{2u}$ , in same way it can produce via the N- acetic acid conversion compound .

【0189】

In addition, the compound of this invention where  $A^1$  of aforementioned (1) is respectively displayed with oxo thiophen ring or dithiolene ring can produce like below even with method .

【0190】

[Chemical Formula 28]



## [0191]

(Y<sup>3</sup>, Y<sup>4</sup> および L<sup>4</sup> は前述と同じ意味を表し、A<sup>3</sup> は A<sup>2</sup> と同じ意味を表し、L<sup>12</sup> および L<sup>13</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルを表すかまたは、L<sup>12</sup> と L<sup>13</sup> とが一緒になって、ピペラジン環、モルホリン環またはピロリジン環を表す。)

A<sup>1</sup> がオキシチオレン環のとき、市販のテトラメチルチオウレア(58)とケトン化合物(16)とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、反応させることによりオキサチオレンイミニウム塩(59)とすることが出来る。

さらに、得られた(59)をヘテロ環アミン類(60)と反応させることにより、本発明化合物(1-27)を得ることが出来る。

## [0192]

また、A<sup>1</sup> がジチオレン環のとき、アミン(61)を二硫化炭素およびケトン化合物(16)で順次処理することにより、ジチオカーバメート化合物(62)とした後、濃硫酸またはテトラフルオロホウ酸にて脱水することにより、ジチオレンイミニウム塩(63)とすることが出来る。

さらに、得られた(63)をヘテロ環アミン類(60)と反応させることにより、本発明化合物(1-28)を得ることが出来る。

## [0193]

テトラメチルチオウレア(58)からオキサチオレンイミニウム塩(59)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等

## [0191]

(Y<sup>3</sup>, Y<sup>4</sup> and L<sup>4</sup> display same meaning as earlier description, A<sup>3</sup> displays same meaning as A<sup>2</sup>, the L<sup>12</sup> and L<sup>13</sup> display C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl or or, L<sup>12</sup> and L<sup>13</sup> become simultaneous, display piperazine ring, morpholine ring or pyrrolidine ring.)

When A<sup>1</sup> is oxo thiophen ring, commercial tetramethyl thiourea (58) with oxa thiophen iminium salt (59) with todo it is possible ketone compound (16) in according to need solvent and under according to need base existing, by reacting.

Furthermore, the compound of this invention (1 - 27) can be acquired (59) which is acquired the heterocyclic ring amines (60) with by reacting.

## [0192]

In addition, when A<sup>1</sup> is dithiolene ring, dithiolene iminium salt (63) with it is possible after doing, by dehydration doing with concentrated sulfuric acid or tetrafluoroboric acid amine (61) by sequential treating with carbon disulfide and ketone compound (16), dithiocarbamate compound (62) with, to do.

Furthermore, the compound of this invention (1 - 28) can be acquired (63) which is acquired the heterocyclic ring amines (60) with by reacting.

## [0193]

If it is a inactivity in reaction, as solvent at time of reacting which obtains oxa thiophen iminium salt (59) from [tetraeramechiruchiourea] (58), it is good, for example diethyl ether, tetrahydrofuran, dimethoxyethane, dioxane or other ethers, benzene, xylene, toluene or other aromatic hydrocarbons, dichloromethane, chloroform, 1, 2-dichloroethane or other halogenated hydrocarbons, ethylacetate or other esters, acetone, methylethyl ketone or

のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(16)は(58)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

オキサチオレンイミニウム塩(59)から本発明化合物(1-28)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides or pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or can list these mixed solvent , etc can list preferably , dioxane , tetrahydrofuran , benzene , xylene , toluene , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetonitrile , dimethylformamide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (16) in range of 50 equivalent vis-a-vis (58), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

If it is a inactivity in reaction, as solvent at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 28) from oxa thiophen iminium salt (59), it is good, for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane , dioxane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides or pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or can list these mixed solvent , etc can list preferably , dioxane , tetrahydrofuran , benzene , xylene , toluene , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetonitrile , dimethylformamide etc.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

In addition, it is possible also to use pyridine etc as solvent .

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、塩基は(59)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

基質の当量としては、(60)は(59)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### [0194]

アミン化合物(61)からジチオカーバメート化合物(62)を経てジチオレンイミニウム塩(63)を得る反応は、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem.Pharm.Bull)第 17 巻、1924 頁(1969 年)、テトラヘドロン・レターズ(Tetrahedron Letters)1137 頁(1971 年)およびケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem.Pharm.Bull)第 20 巻、1711 頁(1972 年)に記載の方法あるいはその方法に準じて行うことができる。

ジチオレンイミニウム塩(63)から本発明化合物(1-29)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.5 be able to use base in range of 50 equivalent vis-a-vis (59), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (60) in range of 50 equivalent vis-a-vis (59), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### [0194]

Passing by dithiocarbamate compound (62) from amine compound (61), to do chemical \* and \* [faamashuutikaru] \*bulletin (Chem .Pharm .Bull ) Vol.17 , 1924page (1969) , Tetrahedron Letters (0040 - 4039, TELEAY ) (Tetrahedron (0040 - 4020, TETRAB ) Letters ) 1137 page (1971 ) and method which it states in chemical \* and \* [faamashuutikaru] \*bulletin (Chem .Pharm .Bull ) Vol. 20 , 1711page (1972 ) or according to method it is possible reaction which obtains dithiolene iminium salt (63).

If it is a inactivity in reaction, as solvent at time of reacting which obtains the compound of this invention (1 - 29) from dithiolene iminium salt (63), it is good, for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane , dioxane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2-dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides or pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons or can list these mixed solvent , etc can list preferably , dioxane , tetrahydrofuran , benzene , xylene , toluene , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetonitrile , dimethylformamide etc.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

In addition, it is possible also to use pyridine etc as solvent .

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling



図が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、塩基は(63)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

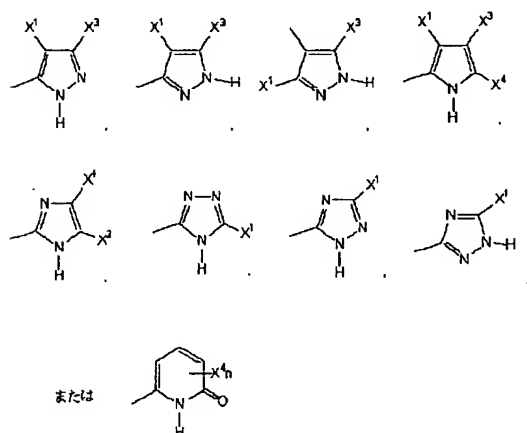
基質の当量としては、(60)は(63)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

[0195]

また、A<sup>3</sup> が

[0196]

[化 29]

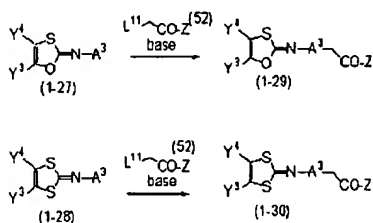


[0197]

(X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> および n は前述と同じ意味を表す。) のとき、

[0198]

[化 30]



[0199]

(Y<sup>3</sup>, Y<sup>4</sup>, A<sup>3</sup>, L<sup>11</sup> および Z は前述と同じ意味を表す。)

point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time, it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour.

As equivalent of base, from 0.5 be able to use base in range of 50 equivalent vis-a-vis (63), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

As equivalent of substrate, from 0.5 be able to use (60) in range of 50 equivalent vis-a-vis (63), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

[0195]

In addition, A<sup>3</sup> is

[0196]

[Chemical Formula 29]

[0197]

At time of (X<sup>1</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> and n display same meaning as earlier description. ),

[0198]

[Chemical Formula 30]

[0199]

(Y<sup>3</sup>, Y<sup>4</sup>, A<sup>3</sup>, L<sup>11</sup> and Z display same meaning as earlier description. )

す。)

前述と同様に得られた(1-27)または(1-28)を必要に応じて塩基存在下、必要に応じて溶媒中、ハロ酢酸化合物(52)で処理することにより本発明化合物(1-29)または(1-30)をそれぞれ得ることが出来る。

#### 【0200】

(1-27)または(1-28)から本発明化合物(1-29)または(1-30)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。

塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。

触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。

反応温度は、-80 deg C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0 deg C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。

反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。

塩基の当量としては、(1-27)または(1-28)に対して、0.05 から 150 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

また、基質の当量としては、(52)は(1-27)または(1-28)に対して、0.5 から 50 当量の範囲で用いることができ、1 から 20 当量の範囲が好ましい。

#### 【0201】

L<sup>11</sup> and Z display same meaning as earlier description. )

the compound of this invention (1 - 29) or (1 - 30) can be acquired respectively it acquired in the same way as earlier description (1 - 27) or (1 - 28) under according to need base existing and in according to need solvent , by treating with haloacetic acid compound (52).

#### [0200]

If it should have been a inactivity in reaction, as solvent (1 - 27) or the the compound of this invention (1 - 29) or at time of reacting which obtains (1 - 30) from (1 - 28), for example diethyl ether , tetrahydrofuran , dimethoxyethane or other ethers , benzene , xylene , toluene or other aromatic hydrocarbons , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane or other halogenated hydrocarbons , ethylacetate or other esters , acetone , methylethyl ketone or other ketones , acetonitrile , propionitrile or other nitriles , dimethylformamide , dimethylacetamide , N- methyl pyrrolidone or other amides , pentane , hexane , cyclohexane or other aliphatic hydrocarbons , dimethyl sulfoxide or water or these mixed solvent etc can list, preferably , tetrahydrofuran , benzene , xylene , toluene , dichloromethane , chloroform , 1, 2- dichloroethane , acetonitrile , dimethylformamide etc can list.

As base , it can use for example triethylamine , tributyl amine , pyridine , N- methyl piperidine , 4- dimethylamino pyridine or other organic base and potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate , sodium hydroxide , potassium hydroxide , sodium hydride or other inorganic base .

As catalyst , it can use for example tetra -N- butyl ammonium bromide etc.

As for reaction temperature , - it is possible from 80 deg C to do in range of the boiling point of solvent , range of boiling point of solvent is desirable from 0 deg C.

As reaction time , it is possible from 5 min to do in range of 100 hours, range of 48 hours is desirable from 1 hour .

As equivalent of base , from 0.05 be able to use in range of 150 equivalent (1 - 27) or vis-a-vis (1 - 28), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

In addition, as equivalent of substrate , from 0.5 be able to use (52) in range of 50 equivalent (1 - 27) or vis-a-vis (1 - 28), range of 1 to 20 equivalent is desirable.

#### [0201]

それぞれの工程で製造される本発明化合物またはその中間体は常法により反応液から得ることができるが、化合物を精製する必要が生じた場合には、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

【0202】

次に、本発明に包含される化合物の例を第1表から第5表に示す。

但し、本発明化合物は、これらのみに限定されるものではない。

【0203】

なお、表中の略号はそれぞれ以下の意味を示す。

【0204】

Me:メチル基、Et:エチル基、Pr:プロピル基、Bu:ブチル基、Pen:ペンチル基、Hex:ヘキシル基、Hep:ヘプチル基、Oct:オクチル基、Non:ノニル基、Dec:デシル基、Undec:ウンデカニル基、Dodec:ドデシル基、Ph:フェニル基、n:ノーマル、i:イソ、s:セカンダリー、t:ターシャリー、c:シクロ。

【0205】

また、表中の Ya の意味は前記と異なる。

【0206】

〔第1表〕

【0207】

【化31】

the compound of this invention which is produced with respective step or intermediate it can acquire from reaction mixture with conventional method, but when necessity to refine compound occurs, separation and purification is possible with purification method of the recrystallization, column chromatography or other option.

[0202]

Next, example of compound which is included in this invention from the Table 1 is shown in Table 5.

However, the compound of this invention is not something which is limited in only these.

[0203]

Furthermore, code of in the table shows meaning below each one.

[0204]

As for Me:methyl group, Et:ethyl group, Pr:propyl group, Bu:butyl group, Pen:pentyl group, Hex:hexyl group, Hep:heptyl group, Oct:octyl group, Non:nonyl group, Dec:decyl group, Undec:undecanyl group, Dodec:dodecyl group, Ph:phenyl group, n:normal, i:iso, s:secondary, t:tertiary, c:cyclo.

[0205]

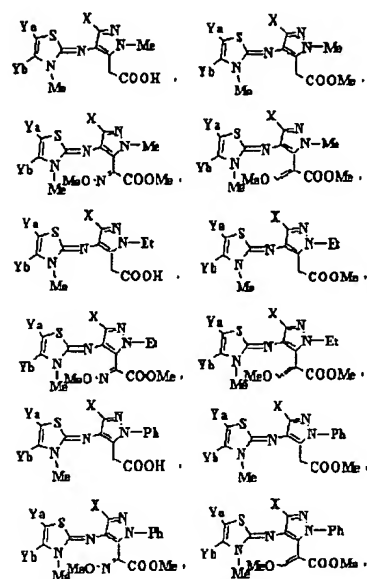
In addition, meaning of Ya of in the table differs from description above.

[0206]

{Table 1 }

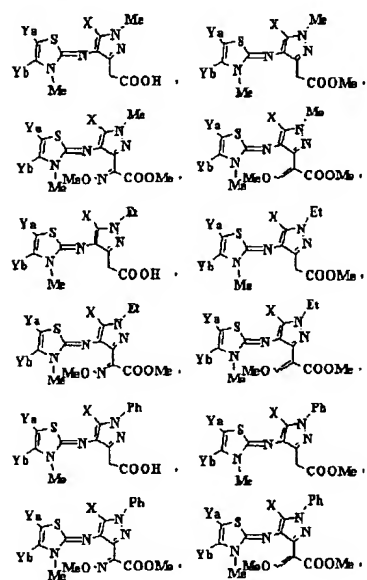
[0207]

[Chemical Formula 31]



[0208]

[化 32]



[0208]

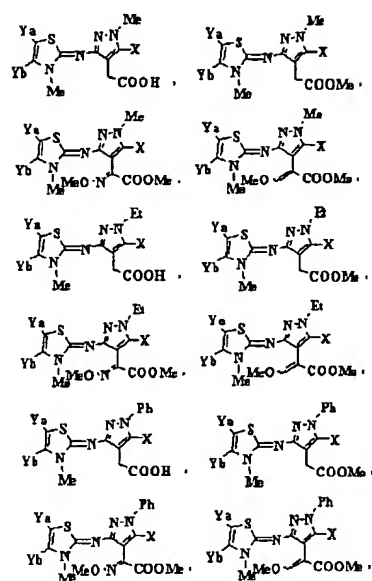
[Chemical Formula 32]

[0209]

[化 33]

[0209]

[Chemical Formula 33]

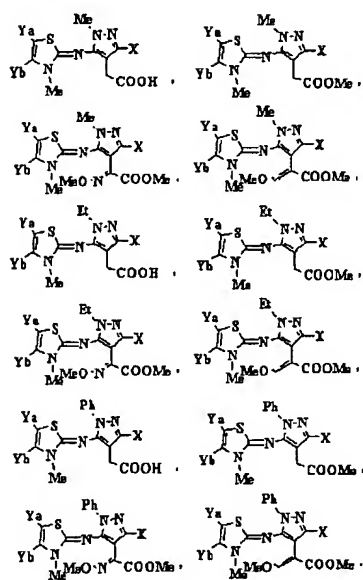


[0210]

[0210]

[化 34]

[Chemical Formula 34]

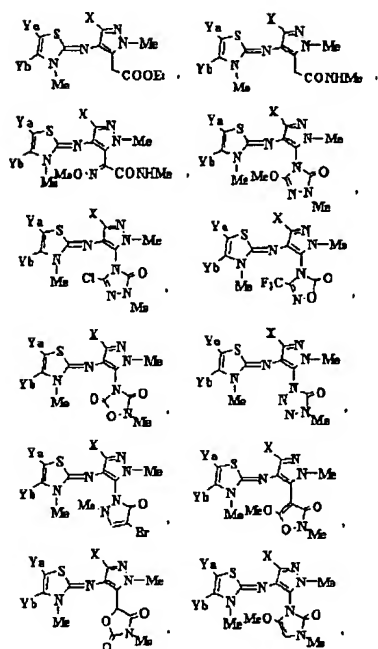


[0211]

[0211]

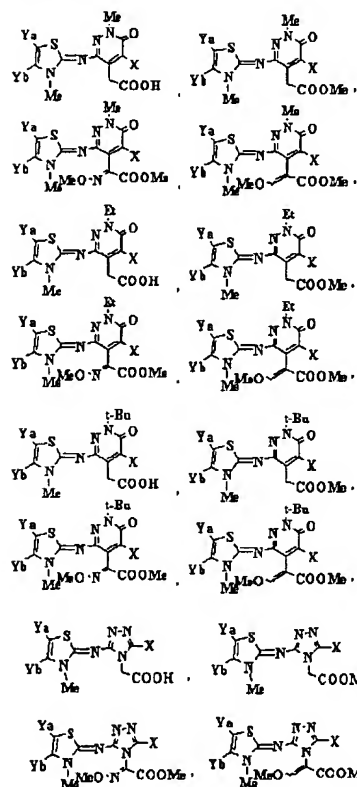
[化 35]

[Chemical Formula 35]



[0212]

[化 36]

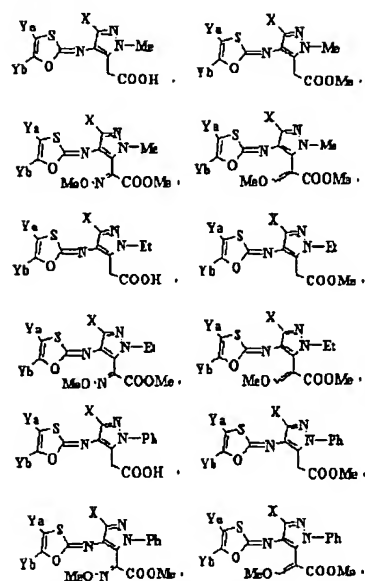


[0212]

[Chemical Formula 36]

[0213]

【化 37】

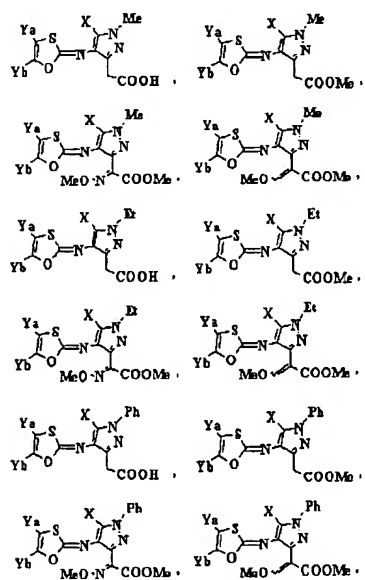


[0213]

[Chemical Formula 37]

[0214]

【化 38】



[0214]

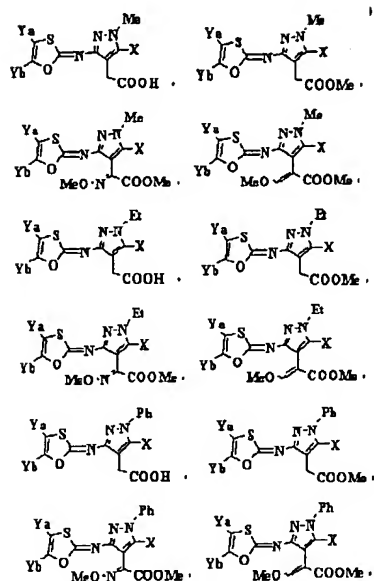
[Chemical Formula 38]

[0215]

【化 39】

[0215]

[Chemical Formula 39]

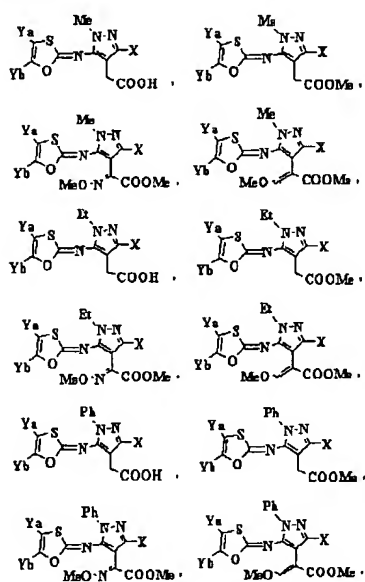


【0216】

[0216]

【化 40】

[Chemical Formula 40]



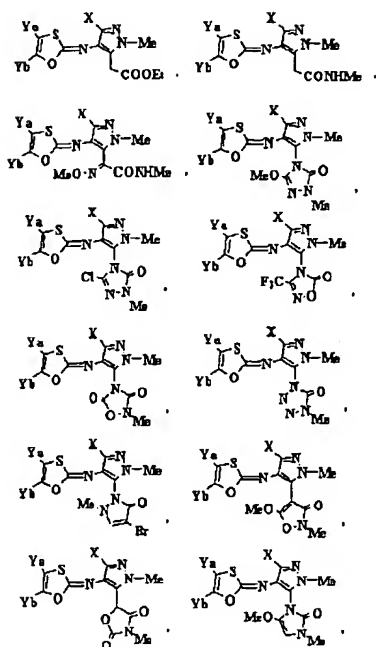
【0217】

[0217]

【化 41】

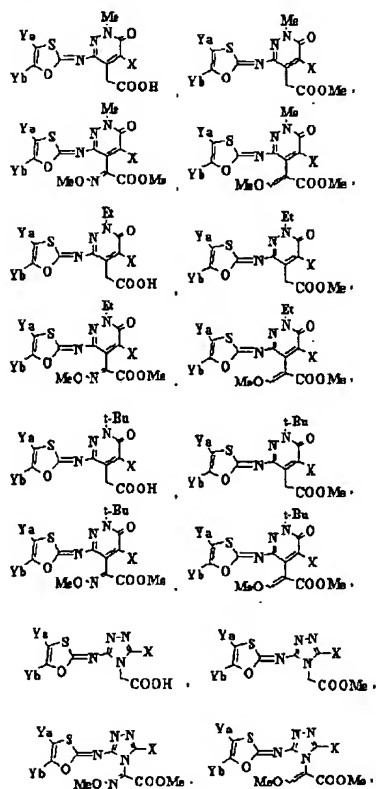
[Chemical Formula 41]





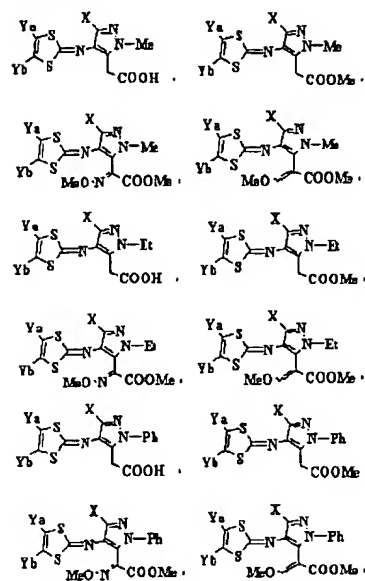
[0218]

[Chemical Formula 42]



【0219】

【化 43】

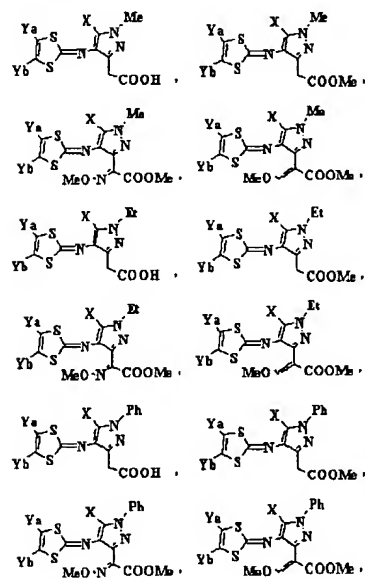


【0219】

【Chemical Formula 43】

【0220】

【化 44】



【0220】

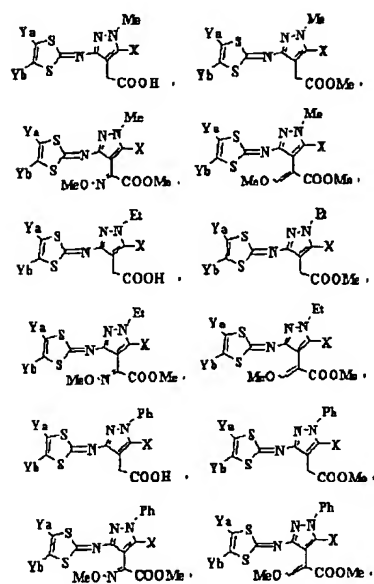
【Chemical Formula 44】

【0221】

【化 45】

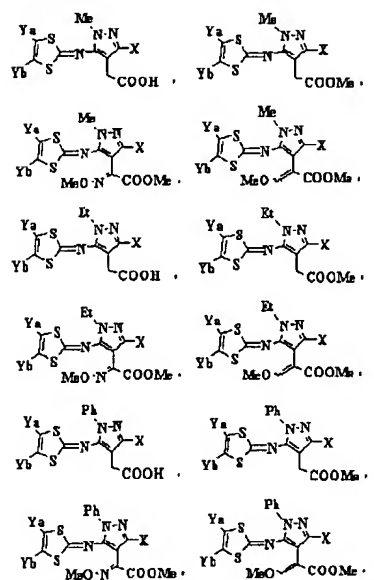
【0221】

【Chemical Formula 45】



[0222]

[化 46]



[0223]

[化 47]

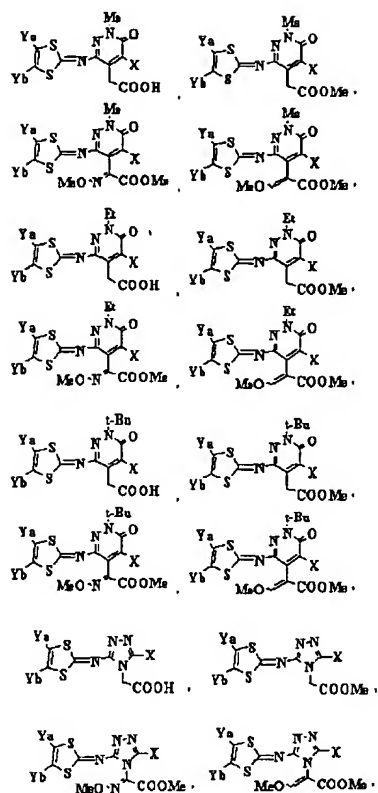
[0222]

[Chemical Formula 46]



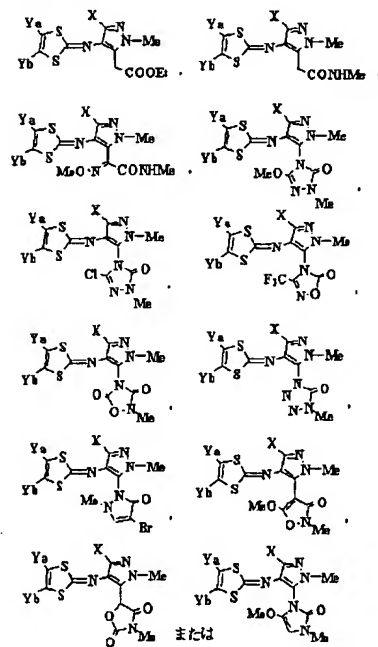
[0223]

[Chemical Formula 47]



【0224】

【化 48】

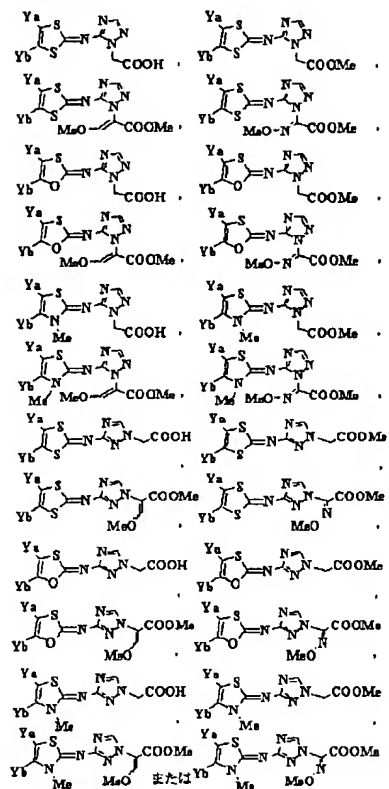


[0224]

[Chemical Formula 48]

[0225]

[Chemical Formula 49]



[0226]

[Table 1]

Y a Y b X

H i-Pr H	H i- Pr H
H n-Bu H	H n- Bu H
H i-Bu H	H i- Bu H
H s-Bu H	H s-Bu H
H t-Bu H	H t-Bu H
H n-Pen H	H n- Pen H
H 3-Me-n-Bu H	H 3- Me-n- Bu H
H n-Hex H	H n- Hex H
H Ethenyl H	H Ethenyl H
H 1-Propenyl H	H 1- Propenyl H
H Ethynyl H	H Ethynyl H
H CF <sub>3</sub> H	HC F <sub>3</sub> H
H c-Pr H	H c-Pr H
H c-Hex H	H c-Hex H
H MeO H	H MeO H
H t-BuO H	H t-BuO H
H CF <sub>3</sub> O H	HC F <sub>3</sub> O H
H MeS H	H MeS H
H MeSO H	H MeSO H
H MeSO <sub>2</sub> H	H MeSO <sub>2</sub> H
H NO <sub>2</sub> H	H NO <sub>2</sub> H
H NC H	H NC H
H CHO H	HC HO H
H Me <sub>2</sub> N H	H Me <sub>2</sub> N H
H PhCH <sub>2</sub> H	H PhCH <sub>2</sub> H
H PhCH=CH H	H PhCH=CH H
H 4-Cl-PHCH=CH H	H 4- Cl-PHCH=CH H
H PhCH=CHCH <sub>2</sub> H	H PhCH=CHCH <sub>2</sub> H
H PhCC H	H PhCC H
H Ph H	H Ph H
H MeNHC(O) H	H MeNHC (O ) H
H PhNHC(O) H	H PhNHC (O ) H
H EtNHC(O) H	H EtNHC (O ) H
H 2-F-PhNHC(O) H	H 2- F-PhNHC (O ) H
H 3-F-PhNHC(O) H	H 3- F-PhNHC (O ) H

H 4-F-PhNHC(O) H	H 4- F-PhNHC (O ) H
H 2-Cl-PhNHC(O) H	H 2- Cl-PhNHC (O ) H
H 3-Cl-PhNHC(O) H	H 3- Cl-PhNHC (O ) H
H 4-Cl-PhNHC(O) H	H 4- Cl-PhNHC (O ) H
H 2-Me-PhNHC(O) H	H 2- Me-PhNHC (O ) H
H 3-Me-PhNHC(O) H	H 3- Me-PhNHC (O ) H
H 4-Me-PhNHC(O) H	H 4- Me-PhNHC (O ) H
H 2-Br-PhNHC(O) H	H 2- Br-PhNHC (O ) H
H 3-Br-PhNHC(O) H	H 3- Br-PhNHC (O ) H
H 4-Br-PhNHC(O) H	H 4- Br-PhNHC (O ) H
H 2-MeO-PhNHC(O) H	H 2- MeO-PhNHC (O ) H
H 3-MeO-PhNHC(O) H	H 3- MeO-PhNHC (O ) H
H 4-MeO-PhNHC(O) H	H 4- MeO-PhNHC (O ) H
H 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) H	H 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) H
H MeOC(O) H	H MeOC (O ) H
H MeOCH <sub>2</sub> H	H MeOCH <sub>2</sub> H
H MeOC(=NOMe) H	H MeOC (=NOMe ) H
H MeC(=NOMe) H	H MeC (=NOMe ) H
H MeC(O) H	H MeC (O ) H
H CH <sub>2</sub> SMe H	HC H <sub>2</sub> SMe H
H CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H	HC H <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H
H Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> H	H Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> H
H ClCH <sub>2</sub> H	HCl CH <sub>2</sub> H
H BrCH <sub>2</sub> H	H BrCH <sub>2</sub> H
H CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H	HC F <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H
H PhC(O)NH H	H PhC (O ) NH H
H 1-Naphthyl H	H 1- Naphthyl H
H 2-Naphthyl H	H 2- Naphthyl H
H 1-Me-Pyrazol-5-yl H	H 1- Me-Pyrazol-5-yl H
H 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl H	H 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl H
H 2-F-Furan-3-yl H	H 2- F-Furan-3- yl H
H Oxazol-2-yl H	H Oxazol-2- yl H
H 1,2,4-Oxadiazol-3-yl H	H 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl H
H 1,2,4-Thiadiazol-5-yl H	H 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl H
H 1,2,4-Triazol-1-yl H	H 1, 2, 4- Triazol-1- yl H

H 1,2,3-Triazol-1-yl H	H 1, 2, 3- Triazol-1- yl H
H 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl H	H 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl H
H 6-MeO-Pyrimidin-2-yl H	H 6-MeO-Pyrimidin-2- yl H
H Pyridazin-3-yl H	H Pyridazin-3- yl H
H 1,3,5-Triazin-2-yl H	H 1, 3, 5-Triazin-2- yl H
H 1,2,4-Triazin-6-yl H	H 1, 2, 4- Triazin-6-yl H
H 1-Me-Pyrrol-2-yl H	H 1- Me-Pyrrol-2- yl H
H Furan-2-yl H	HF uran- 2- yl H
H Thiophen-2-yl H	H Thiophen-2- yl H
H Thiazol-5-yl H	H Thiazol-5-yl H
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H	H 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H
H 3-Me-Isothiazol-5-yl H	H 3- Me-Isothiazol-5-yl H
H Isoxazol-5-yl H	H Isoxazol-5-yl H
H 1-Me-Imidazol-5-yl H	H 1- Me-Imidazol-5-yl H
H 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl H	H 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl H
H Pyridin-4-yl H	H Pyridin-4- yl H
H Quinoxalin-2-yl H	H Quinoxalin-2- yl H
H 6-Cl-Quinoxalin-2-yl H	H 6-Cl-Quinoxalin-2- yl H
H 6-F-Quinoxalin-2-yl H	H 6-F-Quinoxalin-2- yl H
H 1-Me-Indol-3-yl H	H 1- Me-Indol-3- yl H
H Benzothiazol-2-yl H	H Benzothiazol-2- yl H
H 5-F-Benzothiazol-2-yl H	H 5-F-Benzothiazol-2- yl H
H 6-F-Benzothiazol-2-yl H	H 6-F-Benzothiazol-2- yl H
H Quinolin-4-yl H	H Quinolin-4- yl H
H Pyrazin-2-yl H	H Pyrazin-2- yl H
H 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H	H 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H
H Benzofuran-2-yl H	H Benzofuran-2- yl H
H Ph H	H Ph H
H 2-Cl-Ph H	H 2- Cl-Ph H
H 3-Cl-Ph H	H 3- Cl-Ph H
H 4-Cl-Ph H	H 4- Cl-Ph H
H 2-F-Ph H	H 2- F-Ph H
H 3-F-Ph H	H 3- F-Ph H
H 4-F-Ph H	H 4- F-Ph H
H 2-Me-Ph H	H 2- Me-Ph H



H 3-Me-Ph H  
 H 4-Me-Ph H  
 H 2-MeO-Ph H  
 H 3-MeO-Ph H  
 H 4-MeO-Ph H  
 H 4-Br-Ph H  
 H 2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
 H 3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph H  
 H 3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2-Cl-4-Me-Ph H  
 H 2-MeO-4-Me-Ph H  
 H 2,4-Me<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2,5-Me<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2,6-F<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2,3,4,5,6-F<sub>5</sub>-Ph H  
 H 4-Et-Ph H  
 H 4-i-Pr-Ph H  
 H 4-t-Bu-Ph H  
 H 4-CF<sub>3</sub>-Ph H  
 H 4-i-PrO-Ph H  
 H 4-t-BuO-Ph H  
 H 4-CHF<sub>2</sub>O-Ph H  
 H 4-CF<sub>3</sub>O-Ph H  
 H 4-MeS-Ph H  
 H 4-CHO-Ph H  
 H 4-NO<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4-CN-Ph H  
 H 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph H  
 H 4-MeC(O)-Ph H  
 H 4-PhC(O)-Ph H  
 H 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4-MeC(O)O-Ph H  
 H 4-Ph-Ph H

H 3- Me-Ph H  
 H 4- Me-Ph H  
 H 2- MeO-Ph H  
 H 3- MeO-Ph H  
 H 4- MeO-Ph H  
 H 4- Br-Ph H  
 H 2, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
 H 3, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2, 4, 6-Cl<sub>3</sub>-Ph H  
 H 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H  
 H 2- Cl-4- Me-Ph H  
 H 2- MeO-4- Me-Ph H  
 H 2, 4- Me<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2, 5-Me<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph H  
 H 2, 3, 4, 5, 6-F<sub>5</sub>-Ph H  
 H 4- Et-Ph H  
 H 4- i- Pr-Ph H  
 H 4- t-Bu-Ph H  
 H 4- CF<sub>3</sub>-Ph H  
 H 4- i- PrO-Ph H  
 H 4- t-BuO-Ph H  
 H 4- CHF <sub>2</sub>-O-Ph H  
 H 4- CF<sub>3</sub>-O-Ph H  
 H 4- MeS-Ph H  
 H 4- CHO-Ph H  
 H 4- NO<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4- CN-Ph H  
 H 4- PhCH<sub>2</sub>-O-Ph H  
 H 4- MeC (O ) -Ph H  
 H 4- PhC (O ) -Ph H  
 H 4- MeOCH<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4- MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
 H 4- MeC (O ) O-Ph H  
 H 4- Ph-Ph H

H 4-PhO-Ph H

H 2,3-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 3,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2,6-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2,3-F<sub>2</sub>-Ph H

H 2,5-F<sub>2</sub>-Ph H

H 3,4-F<sub>2</sub>-Ph H

H 3,5-F<sub>2</sub>-Ph H

H 2,4-F<sub>2</sub>-Ph H

H 2-CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2-F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2-F-6-Cl-Ph H

H 2-F-6-Me-Ph H

H 2-F-6-MeO-Ph H

H 2-F-4-Cl-Ph H

H 2-F-4-CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2-F-4-Me-Ph H

H 2-F-4-MeO-Ph H

H 3-F-4-Cl-Ph H

H 3-F-4-Me-Ph H

H 3-F-4-MeO-Ph H

H 4-F-2-Cl-Ph H

H 4-F-2-Me-Ph H

H 4-F-2-MeO-Ph H

H 4-F-3-Cl-Ph H

H 4-F-3-Me-Ph H

H 4-F-3-MeO-Ph H

H 2-OH-Ph H

H 4-I-Ph H

H 4-MeOC(O)-Ph H

H 2,6-Me<sub>2</sub>-Ph H

H 2,6-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

H 3-CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2-Br-Ph H

H 4- PhO-Ph H

H 2, 3- Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 3, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 6-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 3- F<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 5-F<sub>2</sub>-Ph H

H 3, 4- F<sub>2</sub>-Ph H

H 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph H

H 2- CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2- F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2- F-6-Cl-Ph H

H 2- F-6-Me-Ph H

H 2- F-6-MeO-Ph H

H 2- F-4- Cl-Ph H

H 2- F-4- CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2- F-4- Me-Ph H

H 2- F-4- MeO-Ph H

H 3- F-4- Cl-Ph H

H 3- F-4- Me-Ph H

H 3- F-4- MeO-Ph H

H 4- F-2- Cl-Ph H

H 4- F-2- Me-Ph H

H 4- F-2- MeO-Ph H

H 4- F-3- Cl-Ph H

H 4- F-3- Me-Ph H

H 4- F-3- MeO-Ph H

H 2- OH-Ph H

H 4- I-Ph H

H 4- MeOC (O ) -Ph H

H 2, 6-Me<sub>2</sub>-Ph H

H 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

H 3- CF<sub>3</sub>-Ph H

H 2- Br-Ph H

H 3-Br-Ph H

H 2-MeC(O)-Ph H

H 4-c-Pr-Ph H

H 4-PhS-Ph H

H 2,3-Me<sub>2</sub>-Ph HH 3,4-Me<sub>2</sub>-Ph HH 3,5-Me<sub>2</sub>-Ph HH 2,3-(MeO)<sub>2</sub>-Ph HH 2,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph HH 2,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph HH 3,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

H 2-F-4-I-Ph H

H 2-F-4-EtO-Ph H

H 2-F-6-Ph-Ph H

H 3,4-methylenedioxy-Ph H

H 3,4-ethylenedioxy-Ph H

H 2-F-4-Br-Ph H

H 2-Cl-4-Me-Ph H

H 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph H

-CH=CH-CH=CH- H

-CH=N-CH=CH- H

-N=CH-CH=CH- H

-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- H-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- H-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>- H-CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- H-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>2</sub>Ph)-CH<sub>2</sub>- H-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(Me)-CH<sub>2</sub>- H

-CH=CH-CH=C(OMe)- H

Me H H

Me Cl H

Me F H

Me Br H

Me I H

H 3- Br-Ph H

H 2- MeC (O ) -Ph H

H 4- c-Pr-Ph H

H 4- PhS-Ph H

H 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph HH 3, 4- Me<sub>2</sub>-Ph HH 3, 5-Me<sub>2</sub>-Ph HH 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph HH 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph HH 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph HH 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

H 2- F-4- I-Ph H

H 2- F-4- EtO-Ph H

H 2- F-6-Ph-Ph H

H 3, 4- methylenedioxy-Ph H

H 3, 4- ethylenedioxy-Ph H

H 2- F-4- Br-Ph H

H 2- Cl-4- Me-Ph H

H 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph H

-CH=CH-CH=CH- H

-CH=N- CH=CH- H

-N=CH-CH=CH- H

- (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> - H- (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> - H-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>- H-CO- (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> - H-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>2</sub>Ph)-CH<sub>2</sub>- H-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H

-CH=CH-CH=C (OMe ) -H

Me H H

Me Cl H

Me F H

Me Br H

Me I H

Me Me H	Me Me H
Me Et H	Me Et H
Me n-Pr H	Me n- Pr H
Me i-Pr H	Me i- Pr H
Me n-Bu H	Me n- Bu H
Me i-Bu H	Me i- Bu H
Me s-Bu H	Me s-Bu H
Me t-Bu H	Me t-Bu H
Me n-Pen H	Me n- Pen H
Me 3-Me-n-Bu H	Me 3- Me-n- Bu H
Me n-Hex H	Me n- Hex H
Me Ethenyl H	Me Ethenyl H
Me 1-Propenyl H	Me 1- Propenyl H
Me Ethynyl H	Me Ethynyl H
Me CF <sub>3</sub> H	Me CF <sub>3</sub> H
Me c-Pr H	Me c-Pr H
Me c-Hex H	Me c-Hex H
Me MeO H	Me MeO H
Me t-BuO H	Me t-BuO H
Me CF <sub>3</sub> O H	Me CF <sub>3</sub> O H
Me MeS H	Me MeS H
Me MeSO H	Me MeSO H
Me MeSO <sub>2</sub> H	Me MeSO <sub>2</sub> H
Me NO <sub>2</sub> H	Me NO <sub>2</sub> H
Me NC H	Me NC H
Me CHO H	Me CHO H
Me Me <sub>2</sub> N H	Me Me <sub>2</sub> N H
Me PhCH <sub>2</sub> H	Me PhCH <sub>2</sub> H
Me PhCH=CH H	Me PhCH=CH H
Me 4-Cl-PHCH=CH H	Me 4- Cl-PHCH=CH H
Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> H	Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> H
Me PhCC H	Me PhCC H
Me Ph H	Me Ph H
Me MeNHC(O) H	Me MeNHC (O ) H
Me PhNHC(O) H	Me PhNHC (O ) H

Me EtNHC(O) H	Me EtNHC (O ) H
Me 2-F-PhNHC(O) H	Me 2- F-PhNHC (O ) H
Me 3-F-PhNHC(O) H	Me 3- F-PhNHC (O ) H
Me 4-F-PhNHC(O) H	Me 4- F-PhNHC (O ) H
Me 2-Cl-PhNHC(O) H	Me 2- Cl-PhNHC (O ) H
Me 3-Cl-PhNHC(O) H	Me 3- Cl-PhNHC (O ) H
Me 4-Cl-PhNHC(O) H	Me 4- Cl-PhNHC (O ) H
Me 2-Me-PhNHC(O) H	Me 2- Me-PhNHC (O ) H
Me 3-Me-PhNHC(O) H	Me 3- Me-PhNHC (O ) H
Me 4-Me-PhNHC(O) H	Me 4- Me-PhNHC (O ) H
Me 2-Br-PhNHC(O) H	Me 2- Br-PhNHC (O ) H
Me 3-Br-PhNHC(O) H	Me 3- Br-PhNHC (O ) H
Me 4-Br-PhNHC(O) H	Me 4- Br-PhNHC (O ) H
Me 2-MeO-PhNHC(O) H	Me 2- MeO-PhNHC (O ) H
Me 3-MeO-PhNHC(O) H	Me 3- MeO-PhNHC (O ) H
Me 4-MeO-PhNHC(O) H	Me 4- MeO-PhNHC (O ) H
Me 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) H	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) H
Me MeOC(O) H	Me MeOC (O ) H
Me MeOCH <sub>2</sub> H	Me MeOCH <sub>2</sub> H
Me MeOC(=NOMe) H	Me MeOC (=NOMe ) H
Me MeC(=NOMe) H	Me MeC (=NOMe ) H
Me MeC(O) H	Me MeC (O ) H
Me CH <sub>2</sub> SMe H	Me CH <sub>2</sub> SMe H
Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H	Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H
Me Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> H	Me Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> H
Me ClCH <sub>2</sub> H	Me ClCH <sub>2</sub> H
Me BrCH <sub>2</sub> H	Me BrCH <sub>2</sub> H
Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H	Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H
Me PhC(O)NH H	Me PhC (O ) NH H
Me 1-Naphthyl H	Me 1- Naphthyl H
Me 2-Naphthyl H	Me 2- Naphthyl H
Me 1-Me-Pyrazol-5-yl H	Me 1- Me-Pyrazol-5-yl H
Me 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl H	Me 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl H
Me 2-F-Furan-3-yl H	Me 2- F-Furan-3- yl H
Me Oxazol-2-yl H	Me Oxazol-2- yl H

Me 1,2,4-Oxadiazol-3-yl H	Me 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl H
Me 1,2,4-Thiadiazol-5-yl H	Me 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl H
Me 1,2,4-Triazol-1-yl H	Me 1, 2, 4- Triazol-1- yl H
Me 1,2,3-Triazol-1-yl H	Me 1, 2, 3- Triazol-1- yl H
Me 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl H	Me 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl H
Me 6-MeO-Pyrimidin-2-yl H	Me 6-MeO-Pyrimidin-2- yl H
Me Pyridazin-3-yl H	Me Pyridazin-3- yl H
Me 1,3,5-Triazin-2-yl H	Me 1, 3, 5-Triazin-2- yl H
Me 1,2,4-Triazin-6-yl H	Me 1, 2, 4- Triazin-6-yl H
Me 1-Me-Pyrrol-2-yl H	Me 1- Me-Pyrrol-2- yl H
Me Furan-2-yl H	Me Furan-2- yl H
Me Thiophen-2-yl H	Me Thiophen-2- yl H
Me Thiazol-5-yl H	Me Thiazol-5-yl H
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H
Me 3-Me-Isotiazol-5-yl H	Me 3- Me-Isotiazol-5-yl H
Me Isoxazol-5-yl H	Me Isoxazol-5-yl H
Me 1-Me-Imidazol-5-yl H	Me 1- Me-Imidazol-5-yl H
Me 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl H	Me 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl H
Me Pyridin-4-yl H	Me Pyridin-4- yl H
Me Quinoxalin-2-yl H	Me Quinoxalin-2- yl H
Me 6-Cl-Quinoxalin-2-yl H	Me 6-Cl-Quinoxalin-2- yl H
Me 6-F-Quinoxalin-2-yl H	Me 6-F-Quinoxalin-2- yl H
Me 1-Me-Indol-3-yl H	Me 1- Me-Indol-3- yl H
Me Benzothiazol-2-yl H	Me Benzothiazol-2- yl H
Me 5-F-Benzothiazol-2-yl H	Me 5-F-Benzothiazol-2- yl H
Me 6-F-Benzothiazol-2-yl H	Me 6-F-Benzothiazol-2- yl H
Me Quinolin-4-yl H	Me Quinolin-4- yl H
Me Pyrazin-2-yl H	Me Pyrazin-2- yl H
Me 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H	Me 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H
Me Benzofuran-2-yl H	Me Benzofuran-2- yl H
Me Ph H	Me Ph H
Me 2-Cl-Ph H	Me 2- Cl-Ph H
Me 3-Cl-Ph H	Me 3- Cl-Ph H
Me 4-Cl-Ph H	Me 4- Cl-Ph H
Me 2-F-Ph H	Me 2- F-Ph H

Me 3-F-Ph H	Me 3- F-Ph H
Me 4-F-Ph H	Me 4- F-Ph H
Me 2-Me-Ph H	Me 2- Me-Ph H
Me 3-Me-Ph H	Me 3- Me-Ph H
Me 4-Me-Ph H	Me 4- Me-Ph H
Me 2-MeO-Ph H	Me 2- MeO-Ph H
Me 3-MeO-Ph H	Me 3- MeO-Ph H
Me 4-MeO-Ph H	Me 4- MeO-Ph H
Me 4-Br-Ph H	Me 4- Br-Ph H
Me 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph H
Me 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph H	Me 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> -Ph H
Me 3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph H
Me 2-Cl-4-Me-Ph H	Me 2- Cl-4- Me-Ph H
Me 2-MeO-4-Me-Ph H	Me 2- MeO-4- Me-Ph H
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,5-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 5-Me <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,6-F <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph H	Me 2, 3, 4, 5, 6-F <sub>5</sub> -Ph H
Me 4-Et-Ph H	Me 4- Et-Ph H
Me 4-i-Pr-Ph H	Me 4- i- Pr-Ph H
Me 4-t-Bu-Ph H	Me 4- t-Bu-Ph H
Me 4-CF <sub>3</sub> -Ph H	Me 4- CF <sub>3</sub> -Ph H
Me 4-i-PrO-Ph H	Me 4- i- PrO-Ph H
Me 4-t-BuO-Ph H	Me 4- t-BuO-Ph H
Me 4-CHF <sub>2</sub> O-Ph H	Me 4- CHF <sub>2</sub> O-Ph H
Me 4-CF <sub>3</sub> O-Ph H	Me 4- CF <sub>3</sub> O-Ph H
Me 4-MeS-Ph H	Me 4- MeS-Ph H
Me 4-CHO-Ph H	Me 4- CHO-Ph H
Me 4-NO <sub>2</sub> -Ph H	Me 4- NO <sub>2</sub> -Ph H
Me 4-CN-Ph H	Me 4- CN-Ph H
Me 4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph H	Me 4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph H
Me 4-MeC(O)-Ph H	Me 4- MeC (O ) -Ph H
Me 4-PhC(O)-Ph H	Me 4- PhC (O ) -Ph H
Me 4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph H	Me 4- MeOCH <sub>2</sub> -Ph H

Me 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4-MeC(O)O-Ph H  
Me 4-Ph-Ph H  
Me 4-PhO-Ph H  
Me 2,3-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,6-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,3-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,4-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,4-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-6-Cl-Ph H  
Me 2-F-6-Me-Ph H  
Me 2-F-6-MeO-Ph H  
Me 2-F-4-Cl-Ph H  
Me 2-F-4-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-4-Me-Ph H  
Me 2-F-4-MeO-Ph H  
Me 3-F-4-Cl-Ph H  
Me 3-F-4-Me-Ph H  
Me 3-F-4-MeO-Ph H  
Me 4-F-2-Cl-Ph H  
Me 4-F-2-Me-Ph H  
Me 4-F-2-MeO-Ph H  
Me 4-F-3-Cl-Ph H  
Me 4-F-3-Me-Ph H  
Me 4-F-3-MeO-Ph H  
Me 2-OH-Ph H  
Me 4-I-Ph H  
Me 4-MeOC(O)-Ph H  
Me 2,6-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 4- MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4- MeC ( O ) O-Ph H  
Me 4- Ph-Ph H  
Me 4- PhO-Ph H  
Me 2, 3- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 6-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 3- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 4- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2- CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-6-Cl-Ph H  
Me 2- F-6-Me-Ph H  
Me 2- F-6-MeO-Ph H  
Me 2- F-4- Cl-Ph H  
Me 2- F-4- CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-4- Me-Ph H  
Me 2- F-4- MeO-Ph H  
Me 3- F-4- Cl-Ph H  
Me 3- F-4- Me-Ph H  
Me 3- F-4- MeO-Ph H  
Me 4- F-2- Cl-Ph H  
Me 4- F-2- Me-Ph H  
Me 4- F-2- MeO-Ph H  
Me 4- F-3- Cl-Ph H  
Me 4- F-3- Me-Ph H  
Me 4- F-3- MeO-Ph H  
Me 2- OH-Ph H  
Me 4- I-Ph H  
Me 4- MeOC ( O ) -Ph H  
Me 2, 6-Me<sub>2</sub>-Ph H



Me 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Me 3-CF <sub>3</sub> -Ph H	Me 3- CF<sub>3</sub>-Ph H
Me 2-Br-Ph H	Me 2- Br-Ph H
Me 3-Br-Ph H	Me 3- Br-Ph H
Me 2-MeC(O)-Ph H	Me 2- MeC (O ) -Ph H
Me 4-c-Pr-Ph H	Me 4- c-Pr-Ph H
Me 4-PhS-Ph H	Me 4- PhS-Ph H
Me 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph H
Me 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 4- Me<sub>2</sub>-Ph H
Me 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 5-Me<sub>2</sub>-Ph H
Me 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Me 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Me 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Me 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Me 2-F-4-I-Ph H	Me 2- F-4- I-Ph H
Me 2-F-4-EtO-Ph H	Me 2- F-4- EtO-Ph H
Me 2-F-6-Ph-Ph H	Me 2- F-6-Ph-Ph H
Me 3,4-methylenedioxy-Ph H	Me 3, 4- methylenedioxy-Ph H
Me 3,4-ethylenedioxy-Ph H	Me 3, 4- ethylenedioxy-Ph H
Me 2-F-4-Br-Ph H	Me 2- F-4- Br-Ph H
Me 2-Cl-4-Me-Ph H	Me 2- Cl-4- Me-Ph H
Me 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph H	Me 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph H
Et Et H	Et Et H
Et n-Pr H	Et n- Pr H
Et i-Pr H	Et i- Pr H
Et n-Bu H	Et n- Bu H
Et s-Bu H	Et s-Bu H
Et t-Bu H	Et t-Bu H
Et CF <sub>3</sub> H	Et CF<sub>3</sub> H
Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H	Et CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H
Et 1-Naphthyl H	Et 1- Naphthyl H
Et 2-Naphthyl H	Et 2- Naphthyl H
Et Ph H	Et Ph H
Et 2-Cl-Ph H	Et 2- Cl-Ph H
Et 4-Cl-Ph H	Et 4- Cl-Ph H

Et 2-F-Ph H	Et 2- F-Ph H
Et 4-F-Ph H	Et 4- F-Ph H
Et 2-Me-Ph H	Et 2- Me-Ph H
Et 3-Me-Ph H	Et 3- Me-Ph H
Et 4-Me-Ph H	Et 4- Me-Ph H
Et 2-MeO-Ph H	Et 2- MeO-Ph H
Et 3-MeO-Ph H	Et 3- MeO-Ph H
Et 4-MeO-Ph H	Et 4- MeO-Ph H
Et 4-Br-Ph H	Et 4- Br-Ph H
Et 2,6-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph H
Et 4-CF <sub>3</sub> -Ph H	Et 4- CF<sub>3</sub>-Ph H
Et 4-Ph-Ph H	Et 4- Ph-Ph H
Et 4-PhO-Ph H	Et 4- PhO-Ph H
Et 2,3-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 3- F<sub>2</sub>-Ph H
Et 2,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 5-F<sub>2</sub>-Ph H
Et 3,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 4- F<sub>2</sub>-Ph H
Et 3,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph H
Et 2,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph H
Et 2-F-4-Cl-Ph H	Et 2- F-4- Cl-Ph H
Et 2-F-4-Me-Ph H	Et 2- F-4- Me-Ph H
Et 2-F-4-MeO-Ph H	Et 2- F-4- MeO-Ph H
Et 3-F-4-Cl-Ph H	Et 3- F-4- Cl-Ph H
Et 3-F-4-Me-Ph H	Et 3- F-4- Me-Ph H
Et 3-F-4-MeO-Ph H	Et 3- F-4- MeO-Ph H
Et 4-F-2-Cl-Ph H	Et 4- F-2- Cl-Ph H
Et 4-F-2-Me-Ph H	Et 4- F-2- Me-Ph H
Et 4-F-2-MeO-Ph H	Et 4- F-2- MeO-Ph H
Et 4-F-3-Cl-Ph H	Et 4- F-3- Cl-Ph H
Et 4-F-3-Me-Ph H	Et 4- F-3- Me-Ph H
Et 4-F-3-MeO-Ph H	Et 4- F-3- MeO-Ph H
Et 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
Et 2-Br-Ph H	Et 2- Br-Ph H
Et 3-Br-Ph H	Et 3- Br-Ph H
Et 4-EtO-Ph H	Et 4- EtO-Ph H
Et 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph H

Et 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph H
Et 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph H
Et 2-Cl-3-Me-Ph H	Et 2- Cl-3- Me-Ph H
Et 2-Cl-4-Me-Ph H	Et 2- Cl-4- Me-Ph H
Et 3-Cl-4-Me-Ph H	Et 3- Cl-4- Me-Ph H
Et 4-Cl-2-Me-Ph H	Et 4- Cl-2- Me-Ph H
Et 4-Cl-3-Me-Ph H	Et 4- Cl-3- Me-Ph H
Et 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph H	Et 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph H
Pr Et H	Pr Et H
Pr n-Pr H	Pr n- Pr H
Pr i-Pr H	Pr i- Pr H
Pr s-Bu H	Pr s-Bu H
Pr t-Bu H	Pr t-Bu H
Pr CF <sub>3</sub> H	Pr CF <sub>3</sub> H
Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H	Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H
Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl H	Pr 1- Me-3- Cl-Pyrazol-4- yl H
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl H	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-3- yl H
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl H	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-4- yl H
Pr Ph H	Pr Ph H
Pr 2-Cl-Ph H	Pr 2- Cl-Ph H
Pr 4-Cl-Ph H	Pr 4- Cl-Ph H
Pr 2-F-Ph H	Pr 2- F-Ph H
Pr 4-F-Ph H	Pr 4- F-Ph H
Pr 2-Me-Ph H	Pr 2- Me-Ph H
Pr 4-Me-Ph H	Pr 4- Me-Ph H
Pr 4-Br-Ph H	Pr 4- Br-Ph H
Pr 2,6-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 2,3-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 2,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 3,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 3,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 2,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Pr 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
Pr 2-Br-Ph H	Pr 2- Br-Ph H
Br n-Pr H	Br n- Pr H
Br i-Pr H	Br i- Pr H

Br s-Bu H	Br s-Bu H
Br t-Bu H	Br t-Bu H
Br CF <sub>3</sub> H	Br CF <sub>3</sub> H
Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H	Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H
Br Ph H	Br Ph H
Br 2-Cl-Ph H	Br 2- Cl-Ph H
Br 4-Cl-Ph H	Br 4- Cl-Ph H
Br 2-F-Ph H	Br 2- F-Ph H
Br 4-F-Ph H	Br 4- F-Ph H
Br 2-Me-Ph H	Br 2- Me-Ph H
Br 4-Me-Ph H	Br 4- Me-Ph H
Br 4-Br-Ph H	Br 4- Br-Ph H
i-Pr i-Pr H	i- Pr i- Pr H
i-Pr s-Bu H	i- Pr s-Bu H
i-Pr t-Bu H	i- Pr t-Bu H
i-Pr CF <sub>3</sub> H	i- Pr CF <sub>3</sub> H
i-Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H	i- Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H
i-Pr Ph H	i- Pr Ph H
i-Pr 2-Cl-Ph H	i- Pr 2- Cl-Ph H
i-Pr 4-Cl-Ph H	i- Pr 4- Cl-Ph H
i-Pr 2-F-Ph H	i- Pr 2- F-Ph H
i-Pr 4-F-Ph H	i- Pr 4- F-Ph H
i-Pr 2-Me-Ph H	i- Pr 2- Me-Ph H
i-Pr 4-Me-Ph H	i- Pr 4- Me-Ph H
i-Pr 4-Br-Ph H	i- Pr 4- Br-Ph H
i-Pr 2-Br-Ph H	i- Pr 2- Br-Ph H
H H Cl	H HCl
H Cl Cl	HCl Cl
H F Cl	HFC l
H Br Cl	H Br Cl
H I Cl	H IC l
H Me Cl	H Me Cl
H Et Cl	H Et Cl
H n-Pr Cl	H n- Pr Cl
H i-Pr Cl	H i- Pr Cl

H n-Bu Cl	H n- Bu Cl
H i-Bu Cl	H i- Bu Cl
H s-Bu Cl	H s-Bu Cl
H t-Bu Cl	H t-Bu Cl
H n-Pen Cl	H n- Pen Cl
H 3-Me-n-Bu Cl	H 3- Me-n- Bu Cl
H n-Hex Cl	H n- Hex Cl
H Ethenyl Cl	H Ethenyl Cl
H 1-Propenyl Cl	H 1- Propenyl Cl
H Ethynyl Cl	H Ethynyl Cl
H CF <sub>3</sub> Cl	HC F <sub>3</sub> Cl
H c-Pr Cl	H c-Pr Cl
H c-Hex Cl	H c-Hex Cl
H MeO Cl	H MeO Cl
H t-BuO Cl	H t-BuO Cl
H CF <sub>3</sub> O Cl	HC F <sub>3</sub> O Cl
H MeS Cl	H MeS Cl
H MeSO Cl	H MeSO Cl
H MeSO <sub>2</sub> Cl	H MeSO <sub>2</sub> Cl
H NO <sub>2</sub> Cl	H NO <sub>2</sub> Cl
H NC Cl	H NC Cl
H CHO Cl	HC HO Cl
H Me <sub>2</sub> N Cl	H Me <sub>2</sub> N Cl
H PhCH <sub>2</sub> Cl	H PhCH <sub>2</sub> Cl
H PhCH=CH Cl	H PhCH=CHC l
H 4-Cl-PHCH=CH Cl	H 4- Cl-PHCH=CHC l
H PhCH=CHCH <sub>2</sub> Cl	H PhCH=CHCH <sub>2</sub> Cl
H PhCC Cl	H PhCC Cl
H Ph Cl	H Ph Cl
H MeNHC(O) Cl	H MeNHC (O ) Cl
H PhNHC(O) Cl	H PhNHC (O ) Cl
H EtNHC(O) Cl	H EtNHC (O ) Cl
H 2-F-PhNHC(O) Cl	H 2- F-PhNHC (O ) Cl
H 3-F-PhNHC(O) Cl	H 3- F-PhNHC (O ) Cl
H 4-F-PhNHC(O) Cl	H 4- F-PhNHC (O ) Cl

H 2-Cl-PhNHC(O) Cl	H 2- Cl-PhNHC (O ) Cl
H 3-Cl-PhNHC(O) Cl	H 3- Cl-PhNHC (O ) Cl
H 4-Cl-PhNHC(O) Cl	H 4- Cl-PhNHC (O ) Cl
H 2-Me-PhNHC(O) Cl	H 2- Me-PhNHC (O ) Cl
H 3-Me-PhNHC(O) Cl	H 3- Me-PhNHC (O ) Cl
H 4-Me-PhNHC(O) Cl	H 4- Me-PhNHC (O ) Cl
H 2-Br-PhNHC(O) Cl	H 2- Br-PhNHC (O ) Cl
H 3-Br-PhNHC(O) Cl	H 3- Br-PhNHC (O ) Cl
H 4-Br-PhNHC(O) Cl	H 4- Br-PhNHC (O ) Cl
H 2-MeO-PhNHC(O) Cl	H 2- MeO-PhNHC (O ) Cl
H 3-MeO-PhNHC(O) Cl	H 3- MeO-PhNHC (O ) Cl
H 4-MeO-PhNHC(O) Cl	H 4- MeO-PhNHC (O ) Cl
H 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) Cl	H 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) Cl
H MeOC(O) Cl	H MeOC (O ) Cl
H MeOCH <sub>2</sub> Cl	H MeOCH <sub>2</sub> Cl
H MeOC(=NOMe) Cl	H MeOC (=NOMe ) Cl
H MeC(=NOMe) Cl	H MeC (=NOMe ) Cl
H MeC(O) Cl	H MeC (O ) Cl
H CH <sub>2</sub> SMe Cl	HC H <sub>2</sub> SMe Cl
H CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Cl	HC H <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Cl
H Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> Cl	H Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> Cl
H ClCH <sub>2</sub> Cl	HCl CH <sub>2</sub> Cl
H BrCH <sub>2</sub> Cl	H BrCH <sub>2</sub> Cl
H CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Cl	HC F <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Cl
H PhC(O)NH Cl	H PhC (O ) NH Cl
H 1-Naphthyl Cl	H 1- Naphthyl Cl
H 2-Naphthyl Cl	H 2- Naphthyl Cl
H 1-Me-Pyrazol-5-yl Cl	H 1- Me-Pyrazol-5-yl Cl
H 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl Cl	H 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl Cl
H 2-F-Furan-3-yl Cl	H 2- F-Furan-3- yl Cl
H Oxazol-2-yl Cl	H Oxazol-2- yl Cl
H 1,2,4-Oxadiazol-3-yl Cl	H 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl Cl
H 1,2,4-Thiadiazol-5-yl Cl	H 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl Cl
H 1,2,4-Triazol-1-yl Cl	H 1, 2, 4- Triazol-1- yl Cl
H 1,2,3-Triazol-1-yl Cl	H 1, 2, 3- Triazol-1- yl Cl

H 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl Cl	H 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl Cl
H 6-MeO-Pyrimidin-2-yl Cl	H 6-MeO-Pyrimidin-2- yl Cl
H Pyridazin-3-yl Cl	H Pyridazin-3- yl Cl
H 1,3,5-Triazin-2-yl Cl	H 1, 3, 5-Triazin-2- yl Cl
H 1,2,4-Triazin-6-yl Cl	H 1, 2, 4- Triazin-6-yl Cl
H 1-Me-Pyrrol-2-yl Cl	H 1- Me-Pyrrol-2- yl Cl
H Furan-2-yl Cl	HF uran- 2- yl Cl
H Thiophen-2-yl Cl	H Thiophen-2- yl Cl
H Thiazol-5-yl Cl	H Thiazol-5-yl Cl
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Cl	H 2, 4- Me<sub>2</sub>-Oxazol-5-yl Cl
H 3-Me-Isothiazol-5-yl Cl	H 3- Me-Isothiazol-5-yl Cl
H Isoxazol-5-yl Cl	H Isoxazol-5-yl Cl
H 1-Me-Imidazol-5-yl Cl	H 1- Me-Imidazol-5-yl Cl
H 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl Cl	H 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl Cl
H Pyridin-4-yl Cl	H Pyridin-4- yl Cl
H Quinoxalin-2-yl Cl	H Quinoxalin-2- yl Cl
H 6-Cl-Quinoxalin-2-yl Cl	H 6-Cl-Quinoxalin-2- yl Cl
H 6-F-Quinoxalin-2-yl Cl	H 6-F-Quinoxalin-2- yl Cl
H 1-Me-Indol-3-yl Cl	H 1- Me-Indol-3- yl Cl
H Benzothiazol-2-yl Cl	H Benzothiazol-2- yl Cl
H 5-F-Benzothiazol-2-yl Cl	H 5-F-Benzothiazol-2- yl Cl
H 6-F-Benzothiazol-2-yl Cl	H 6-F-Benzothiazol-2- yl Cl
H Quinolin-4-yl Cl	H Quinolin-4- yl Cl
H Pyrazin-2-yl Cl	H Pyrazin-2- yl Cl
H 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Cl	H 4- CClF<sub>2</sub>-Pyrimidin-5-yl Cl
H Benzofuran-2-yl Cl	H Benzofuran-2- yl Cl
H Ph Cl	H Ph Cl
H 2-Cl-Ph Cl	H 2- Cl-Ph Cl
H 3-Cl-Ph Cl	H 3- Cl-Ph Cl
H 4-Cl-Ph Cl	H 4- Cl-Ph Cl
H 2-F-Ph Cl	H 2- F-Ph Cl
H 3-F-Ph Cl	H 3- F-Ph Cl
H 4-F-Ph Cl	H 4- F-Ph Cl
H 2-Me-Ph Cl	H 2- Me-Ph Cl
H 3-Me-Ph Cl	H 3- Me-Ph Cl

H 4-Me-Ph Cl  
H 2-MeO-Ph Cl  
H 3-MeO-Ph Cl  
H 4-MeO-Ph Cl  
H 4-Br-Ph Cl  
H 2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph Cl  
H 3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2-Cl-4-Me-Ph Cl  
H 2-MeO-4-Me-Ph Cl  
H 2,4-Me<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2,5-Me<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2,6-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2,3,4,5,6-F<sub>5</sub>-Ph Cl  
H 4-Et-Ph Cl  
H 4-i-Pr-Ph Cl  
H 4-t-Bu-Ph Cl  
H 4-CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
H 4-i-PrO-Ph Cl  
H 4-t-BuO-Ph Cl  
H 4-CHF<sub>2</sub>O-Ph Cl  
H 4-CF<sub>3</sub>O-Ph Cl  
H 4-MeS-Ph Cl  
H 4-CHO-Ph Cl  
H 4-NO<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4-CN-Ph Cl  
H 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph Cl  
H 4-MeC(O)-Ph Cl  
H 4-PhC(O)-Ph Cl  
H 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4-MeC(O)O-Ph Cl  
H 4-Ph-Ph Cl  
H 4-PhO-Ph Cl

H 4- Me-Ph Cl  
H 2- MeO-Ph Cl  
H 3- MeO-Ph Cl  
H 4- MeO-Ph Cl  
H 4- Br-Ph Cl  
H 2, 4- Cl<sub><sub>2</sub></sub>-Ph Cl  
H 3, 4- Cl<sub><sub>2</sub></sub>-Ph Cl  
H 2, 4, 6-Cl<sub><sub>3</sub></sub>-Ph Cl  
H 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2- Cl-4- Me-Ph Cl  
H 2- MeO-4- Me-Ph Cl  
H 2, 4- Me<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2, 5-Me<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 2, 3, 4, 5, 6-F<sub>5</sub>-Ph Cl  
H 4- Et-Ph Cl  
H 4- i- Pr-Ph Cl  
H 4- t-Bu-Ph Cl  
H 4- CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
H 4- i- PrO-Ph Cl  
H 4- t-BuO-Ph Cl  
H 4- CHF <sub>2</sub>-O-Ph Cl  
H 4- CF<sub>3</sub>-O-Ph Cl  
H 4- MeS-Ph Cl  
H 4- CHO-Ph Cl  
H 4- NO<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4- CN-Ph Cl  
H 4- PhCH<sub>2</sub>-O-Ph Cl  
H 4- MeC (O ) -Ph Cl  
H 4- PhC (O ) -Ph Cl  
H 4- MeOCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4- MeSCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
H 4- MeC (O ) O-Ph Cl  
H 4- Ph-Ph Cl  
H 4- PhO-Ph Cl</sub></sub></sub>



H 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph Cl
H 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl	H 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
H 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	H 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
H 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	H 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	H 2- CF <sub>3</sub> -Ph Cl
H 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	H 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Cl
H 2-F-6-Cl-Ph Cl	H 2- F-6-Cl-Ph Cl
H 2-F-6-Me-Ph Cl	H 2- F-6-Me-Ph Cl
H 2-F-6-MeO-Ph Cl	H 2- F-6-MeO-Ph Cl
H 2-F-4-Cl-Ph Cl	H 2- F-4- Cl-Ph Cl
H 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	H 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph Cl
H 2-F-4-Me-Ph Cl	H 2- F-4- Me-Ph Cl
H 2-F-4-MeO-Ph Cl	H 2- F-4- MeO-Ph Cl
H 3-F-4-Cl-Ph Cl	H 3- F-4- Cl-Ph Cl
H 3-F-4-Me-Ph Cl	H 3- F-4- Me-Ph Cl
H 3-F-4-MeO-Ph Cl	H 3- F-4- MeO-Ph Cl
H 4-F-2-Cl-Ph Cl	H 4- F-2- Cl-Ph Cl
H 4-F-2-Me-Ph Cl	H 4- F-2- Me-Ph Cl
H 4-F-2-MeO-Ph Cl	H 4- F-2- MeO-Ph Cl
H 4-F-3-Cl-Ph Cl	H 4- F-3- Cl-Ph Cl
H 4-F-3-Me-Ph Cl	H 4- F-3- Me-Ph Cl
H 4-F-3-MeO-Ph Cl	H 4- F-3- MeO-Ph Cl
H 2-OH-Ph Cl	H 2- OH-Ph Cl
H 4-I-Ph Cl	H 4- I-Ph Cl
H 4-MeOC(O)-Ph Cl	H 4- MeOC (O ) -Ph Cl
H 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 6-Me <sub>2</sub> -Ph Cl
H 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	H 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Cl
H 3-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	H 3- CF <sub>3</sub> -Ph Cl
H 2-Br-Ph Cl	H 2- Br-Ph Cl
H 3-Br-Ph Cl	H 3- Br-Ph Cl

H 2-MeC(O)-Ph Cl

H 4-c-Pr-Ph Cl

H 4-PhS-Ph Cl

H 2,3-Me<sub>2</sub>-Ph ClH 3,4-Me<sub>2</sub>-Ph ClH 3,5-Me<sub>2</sub>-Ph ClH 2,3-(MeO)<sub>2</sub>-Ph ClH 2,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph ClH 2,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph ClH 3,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph Cl

H 2-F-4-I-Ph Cl

H 2-F-4-EtO-Ph Cl

H 2-F-6-Ph-Ph Cl

H 3,4-methylenedioxy-Ph Cl

H 3,4-ethylenedioxy-Ph Cl

H 2-F-4-Br-Ph Cl

H 2-Cl-4-Me-Ph Cl

H 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph Cl

-CH=CH-CH=CH- Cl

-CH=N-CH=CH- Cl

-N=CH-CH=CH- Cl

-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- Cl-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- Cl-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>- Cl-CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- Cl-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>2</sub>Ph)-CH<sub>2</sub>- Cl-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(Me)-CH<sub>2</sub>- Cl

-CH=CH-CH=C(OMe)- Cl

Me Cl Cl

Me Cl Cl

Me F Cl

Me Br Cl

Me I Cl

H 2- MeC (O ) -Ph Cl

H 4- c-Pr-Ph Cl

H 4- PhS-Ph Cl

H 2, 3- Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 3, 4- Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 3, 5-Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 2, 3- (MeO ) &lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 2, 4- (MeO ) &lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 2, 5- (MeO ) &lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 3, 5- (MeO ) &lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph Cl

H 2- F-4- I-Ph Cl

H 2- F-4- EtO-Ph Cl

H 2- F-6-Ph-Ph Cl

H 3, 4- methylenedioxy-Ph Cl

H 3, 4- ethylenedioxy-Ph Cl

H 2- F-4- Br-Ph Cl

H 2- Cl-4- Me-Ph Cl

H 2, 4, 6-Me&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph Cl

-CH=CH-CH=CH- Cl

-CH=N- CH=CH- Cl

-N=CH-CH=CH- Cl

- (CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt; ) &lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;- Cl

- (CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt; ) &lt;sub&gt;4&lt;/sub&gt;- Cl

-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-O-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;- Cl

-CO- (CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt; ) &lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;- Cl

-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-CH (CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;Ph )

-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;- Cl

-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-CH (Me )

-CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;- Cl

-CH=CH-CH=C (OMe ) -Cl

Me Cl Cl

Me Cl Cl

Me F Cl

Me Br Cl

Me IC l

Me Me Cl	Me Me Cl
Me Et Cl	Me Et Cl
Me n-Pr Cl	Me n- Pr Cl
Me i-Pr Cl	Me i- Pr Cl
Me n-Bu Cl	Me n- Bu Cl
Me i-Bu Cl	Me i- Bu Cl
Me s-Bu Cl	Me s-Bu Cl
Me t-Bu Cl	Me t-Bu Cl
Me n-Pen Cl	Me n- Pen Cl
Me 3-Me-n-Bu Cl	Me 3- Me-n- Bu Cl
Me n-Hex Cl	Me n- Hex Cl
Me Ethenyl Cl	Me Ethenyl Cl
Me 1-Propenyl Cl	Me 1- Propenyl Cl
Me Ethynyl Cl	Me Ethynyl Cl
Me CF <sub>3</sub> Cl	Me CF <sub>3</sub> Cl
Me c-Pr Cl	Me c-Pr Cl
Me c-Hex Cl	Me c-Hex Cl
Me MeO Cl	Me MeO Cl
Me t-BuO Cl	Me t-BuO Cl
Me CF <sub>3</sub> O Cl	Me CF <sub>3</sub> O Cl
Me MeS Cl	Me MeS Cl
Me MeSO Cl	Me MeSO Cl
Me MeSO <sub>2</sub> Cl	Me MeSO <sub>2</sub> Cl
Me NO <sub>2</sub> Cl	Me NO <sub>2</sub> Cl
Me NC Cl	Me NC Cl
Me CHO Cl	Me CHO Cl
Me Me <sub>2</sub> N Cl	Me Me <sub>2</sub> N Cl
Me PhCH <sub>2</sub> Cl	Me PhCH <sub>2</sub> Cl
Me PhCH=CH Cl	Me PhCH=CHC l
Me 4-Cl-PHCH=CH Cl	Me 4- Cl-PHCH=CHC l
Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> Cl	Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> Cl
Me PhCC Cl	Me PhCC Cl
Me Ph Cl	Me Ph Cl
Me MeNHC(O) Cl	Me MeNHC (O ) Cl
Me PhNHC(O) Cl	Me PhNHC (O ) Cl

Me EtNHC(O) Cl	Me EtNHC (O ) Cl
Me 2-F-PhNHC(O) Cl	Me 2- F-PhNHC (O ) Cl
Me 3-F-PhNHC(O) Cl	Me 3- F-PhNHC (O ) Cl
Me 4-F-PhNHC(O) Cl	Me 4- F-PhNHC (O ) Cl
Me 2-Cl-PhNHC(O) Cl	Me 2- Cl-PhNHC (O ) Cl
Me 3-Cl-PhNHC(O) Cl	Me 3- Cl-PhNHC (O ) Cl
Me 4-Cl-PhNHC(O) Cl	Me 4- Cl-PhNHC (O ) Cl
Me 2-Me-PhNHC(O) Cl	Me 2- Me-PhNHC (O ) Cl
Me 3-Me-PhNHC(O) Cl	Me 3- Me-PhNHC (O ) Cl
Me 4-Me-PhNHC(O) Cl	Me 4- Me-PhNHC (O ) Cl
Me 2-Br-PhNHC(O) Cl	Me 2- Br-PhNHC (O ) Cl
Me 3-Br-PhNHC(O) Cl	Me 3- Br-PhNHC (O ) Cl
Me 4-Br-PhNHC(O) Cl	Me 4- Br-PhNHC (O ) Cl
Me 2-MeO-PhNHC(O) Cl	Me 2- MeO-PhNHC (O ) Cl
Me 3-MeO-PhNHC(O) Cl	Me 3- MeO-PhNHC (O ) Cl
Me 4-MeO-PhNHC(O) Cl	Me 4- MeO-PhNHC (O ) Cl
Me 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) Cl	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) Cl
Me MeOC(O) Cl	Me MeOC (O ) Cl
Me MeOCH <sub>2</sub> Cl	Me MeOCH <sub>2</sub> Cl
Me MeOC(=NOMe) Cl	Me MeOC (=NOMe ) Cl
Me MeC(=NOMe) Cl	Me MeC (=NOMe ) Cl
Me MeC(O) Cl	Me MeC (O ) Cl
Me CH <sub>2</sub> SMe Cl	Me CH <sub>2</sub> SMe Cl
Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Cl	Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Cl
Me Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> Cl	Me Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> Cl
Me ClCH <sub>2</sub> Cl	Me ClCH <sub>2</sub> Cl
Me BrCH <sub>2</sub> Cl	Me BrCH <sub>2</sub> Cl
Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Cl	Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Cl
Me PhC(O)NH Cl	Me PhC (O ) NH Cl
Me 1-Naphthyl Cl	Me 1- Naphthyl Cl
Me 2-Naphthyl Cl	Me 2- Naphthyl Cl
Me 1-Me-Pyrazol-5-yl Cl	Me 1- Me-Pyrazol-5-yl Cl
Me 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl Cl	Me 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl Cl
Me 2-F-Furan-3-yl Cl	Me 2- F-Furan-3- yl Cl
Me Oxazol-2-yl Cl	Me Oxazol-2- yl Cl

Me 1,2,4-Oxadiazol-3-yl Cl	Me 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl Cl
Me 1,2,4-Thiadiazol-5-yl Cl	Me 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl Cl
Me 1,2,4-Triazol-1-yl Cl	Me 1, 2, 4- Triazol-1- yl Cl
Me 1,2,3-Triazol-1-yl Cl	Me 1, 2, 3- Triazol-1- yl Cl
Me 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl Cl	Me 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl Cl
Me 6-MeO-Pyrimidin-2-yl Cl	Me 6-MeO-Pyrimidin-2- yl Cl
Me Pyridazin-3-yl Cl	Me Pyridazin-3- yl Cl
Me 1,3,5-Triazin-2-yl Cl	Me 1, 3, 5-Triazin-2- yl Cl
Me 1,2,4-Triazin-6-yl Cl	Me 1, 2, 4- Triazin-6-yl Cl
Me 1-Me-Pyrrol-2-yl Cl	Me 1- Me-Pyrrol-2- yl Cl
Me Furan-2-yl Cl	Me Furan-2- yl Cl
Me Thiophen-2-yl Cl	Me Thiophen-2- yl Cl
Me Thiazol-5-yl Cl	Me Thiazol-5-yl Cl
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Cl	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Cl
Me 3-Me-Isythiazol-5-yl Cl	Me 3- Me-Isythiazol-5-yl Cl
Me Isoxazol-5-yl Cl	Me Isoxazol-5-yl Cl
Me 1-Me-Imidazol-5-yl Cl	Me 1- Me-Imidazol-5-yl Cl
Me 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl Cl	Me 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl Cl
Me Pyridin-4-yl Cl	Me Pyridin-4- yl Cl
Me Quinoxalin-2-yl Cl	Me Quinoxalin-2- yl Cl
Me 6-Cl-Quinoxalin-2-yl Cl	Me 6-Cl-Quinoxalin-2- yl Cl
Me 6-F-Quinoxalin-2-yl Cl	Me 6-F-Quinoxalin-2- yl Cl
Me 1-Me-Indol-3-yl Cl	Me 1- Me-Indol-3- yl Cl
Me Benzothiazol-2-yl Cl	Me Benzothiazol-2- yl Cl
Me 5-F-Benzothiazol-2-yl Cl	Me 5-F-Benzothiazol-2- yl Cl
Me 6-F-Benzothiazol-2-yl Cl	Me 6-F-Benzothiazol-2- yl Cl
Me Quinolin-4-yl Cl	Me Quinolin-4- yl Cl
Me Pyrazin-2-yl Cl	Me Pyrazin-2- yl Cl
Me 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Cl	Me 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Cl
Me Benzofuran-2-yl Cl	Me Benzofuran-2- yl Cl
Me Ph Cl	Me Ph Cl
Me 2-Cl-Ph Cl	Me 2- Cl-Ph Cl
Me 3-Cl-Ph Cl	Me 3- Cl-Ph Cl
Me 4-Cl-Ph Cl	Me 4- Cl-Ph Cl
Me 2-F-Ph Cl	Me 2- F-Ph Cl

Me 3-F-Ph Cl

Me 3- F-Ph Cl

Me 4-F-Ph Cl

Me 4- F-Ph Cl

Me 2-Me-Ph Cl

Me 2- Me-Ph Cl

Me 3-Me-Ph Cl

Me 3- Me-Ph Cl

Me 4-Me-Ph Cl

Me 4- Me-Ph Cl

Me 2-MeO-Ph Cl

Me 2- MeO-Ph Cl

Me 3-MeO-Ph Cl

Me 3- MeO-Ph Cl

Me 4-MeO-Ph Cl

Me 4- MeO-Ph Cl

Me 4-Br-Ph Cl

Me 4- Br-Ph Cl

Me 2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph ClMe 2, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph ClMe 3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph ClMe 3, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph ClMe 2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph ClMe 2, 4, 6-Cl<sub>3</sub>-Ph ClMe 3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph ClMe 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl

Me 2-Cl-4-Me-Ph Cl

Me 2- Cl-4- Me-Ph Cl

Me 2-MeO-4-Me-Ph Cl

Me 2- MeO-4- Me-Ph Cl

Me 2,4-Me<sub>2</sub>-Ph ClMe 2, 4- Me<sub>2</sub>-Ph ClMe 2,5-Me<sub>2</sub>-Ph ClMe 2, 5-Me<sub>2</sub>-Ph ClMe 2,6-F<sub>2</sub>-Ph ClMe 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph ClMe 2,3,4,5,6-F<sub>5</sub>-Ph ClMe 2, 3, 4, 5, 6-F<sub>5</sub>-Ph Cl

Me 4-Et-Ph Cl

Me 4- Et-Ph Cl

Me 4-i-Pr-Ph Cl

Me 4- i- Pr-Ph Cl

Me 4-t-Bu-Ph Cl

Me 4- t-Bu-Ph Cl

Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph ClMe 4- CF<sub>3</sub>-Ph Cl

Me 4-i-PrO-Ph Cl

Me 4- i- PrO-Ph Cl

Me 4-t-BuO-Ph Cl

Me 4- t-BuO-Ph Cl

Me 4-CHF<sub>2</sub>O-Ph ClMe 4- CHF <sub>2</sub>O-Ph ClMe 4-CF<sub>3</sub>O-Ph ClMe 4- CF<sub>3</sub>O-Ph Cl

Me 4-MeS-Ph Cl

Me 4- MeS-Ph Cl

Me 4-CHO-Ph Cl

Me 4- CHO-Ph Cl

Me 4-NO<sub>2</sub>-Ph ClMe 4- NO<sub>2</sub>-Ph Cl

Me 4-CN-Ph Cl

Me 4- CN-Ph Cl

Me 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph ClMe 4- PhCH<sub>2</sub>O-Ph Cl

Me 4-MeC(O)-Ph Cl

Me 4- MeC (O ) -Ph Cl

Me 4-PhC(O)-Ph Cl

Me 4- PhC (O ) -Ph Cl

Me 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph ClMe 4- MeOCH<sub>2</sub>-Ph Cl

Me 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 4-MeC(O)O-Ph Cl  
Me 4-Ph-Ph Cl  
Me 4-PhO-Ph Cl  
Me 2,3-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3,5-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2,6-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2,5-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2,3-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2,5-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3,4-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3,5-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2,4-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2-CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2-F-6-CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2-F-6-Cl-Ph Cl  
Me 2-F-6-Me-Ph Cl  
Me 2-F-6-MeO-Ph Cl  
Me 2-F-4-Cl-Ph Cl  
Me 2-F-4-CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2-F-4-Me-Ph Cl  
Me 2-F-4-MeO-Ph Cl  
Me 3-F-4-Cl-Ph Cl  
Me 3-F-4-Me-Ph Cl  
Me 3-F-4-MeO-Ph Cl  
Me 4-F-2-Cl-Ph Cl  
Me 4-F-2-Me-Ph Cl  
Me 4-F-2-MeO-Ph Cl  
Me 4-F-3-Cl-Ph Cl  
Me 4-F-3-Me-Ph Cl  
Me 4-F-3-MeO-Ph Cl  
Me 2-OH-Ph Cl  
Me 4-I-Ph Cl  
Me 4-MeOC(O)-Ph Cl  
Me 2,6-Me<sub>2</sub>-Ph Cl

Me 4- MeSCH<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 4- MeC ( O ) O-Ph Cl  
Me 4- Ph-Ph Cl  
Me 4- PhO-Ph Cl  
Me 2, 3- Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2, 6-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2, 3- F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2, 5-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3, 4- F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph Cl  
Me 2- CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2- F-6-CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2- F-6-Cl-Ph Cl  
Me 2- F-6-Me-Ph Cl  
Me 2- F-6-MeO-Ph Cl  
Me 2- F-4- Cl-Ph Cl  
Me 2- F-4- CF<sub>3</sub>-Ph Cl  
Me 2- F-4- Me-Ph Cl  
Me 2- F-4- MeO-Ph Cl  
Me 3- F-4- Cl-Ph Cl  
Me 3- F-4- Me-Ph Cl  
Me 3- F-4- MeO-Ph Cl  
Me 4- F-2- Cl-Ph Cl  
Me 4- F-2- Me-Ph Cl  
Me 4- F-2- MeO-Ph Cl  
Me 4- F-3- Cl-Ph Cl  
Me 4- F-3- Me-Ph Cl  
Me 4- F-3- MeO-Ph Cl  
Me 2- OH-Ph Cl  
Me 4- I-Ph Cl  
Me 4- MeOC ( O ) -Ph Cl  
Me 2, 6-Me<sub>2</sub>-Ph Cl

Me 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl
Me 3-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	Me 3- CF<sub>3</sub>-Ph Cl
Me 2-Br-Ph Cl	Me 2- Br-Ph Cl
Me 3-Br-Ph Cl	Me 3- Br-Ph Cl
Me 2-MeC(O)-Ph Cl	Me 2- MeC (O ) -Ph Cl
Me 4-c-Pr-Ph Cl	Me 4- c-Pr-Ph Cl
Me 4-PhS-Ph Cl	Me 4- PhS-Ph Cl
Me 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph Cl
Me 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 3, 4- Me<sub>2</sub>-Ph Cl
Me 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 3, 5-Me<sub>2</sub>-Ph Cl
Me 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl
Me 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl
Me 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl
Me 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Me 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Cl
Me 2-F-4-I-Ph Cl	Me 2- F-4- I-Ph Cl
Me 2-F-4-EtO-Ph Cl	Me 2- F-4- EtO-Ph Cl
Me 2-F-6-Ph-Ph Cl	Me 2- F-6-Ph-Ph Cl
Me 3,4-methylenedioxy-Ph Cl	Me 3, 4- methylenedioxy-Ph Cl
Me 3,4-ethylenedioxy-Ph Cl	Me 3, 4- ethylenedioxy-Ph Cl
Me 2-F-4-Br-Ph Cl	Me 2- F-4- Br-Ph Cl
Me 2-Cl-4-Me-Ph Cl	Me 2- Cl-4- Me-Ph Cl
Me 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph Cl	Me 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph Cl
Et Et Cl	Et Et Cl
Et n-Pr Cl	Et n- Pr Cl
Et i-Pr Cl	Et i- Pr Cl
Et n-Bu Cl	Et n- Bu Cl
Et s-Bu Cl	Et s-Bu Cl
Et t-Bu Cl	Et t-Bu Cl
Et CF <sub>3</sub> Cl	Et CF<sub>3</sub> Cl
Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl	Et CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> Cl
Et 1-Naphthyl Cl	Et 1- Naphthyl Cl
Et 2-Naphthyl Cl	Et 2- Naphthyl Cl
Et Ph Cl	Et Ph Cl
Et 2-Cl-Ph Cl	Et 2- Cl-Ph Cl
Et 4-Cl-Ph Cl	Et 4- Cl-Ph Cl



Et 2-F-Ph Cl	Et 2- F-Ph Cl
Et 4-F-Ph Cl	Et 4- F-Ph Cl
Et 2-Me-Ph Cl	Et 2- Me-Ph Cl
Et 3-Me-Ph Cl	Et 3- Me-Ph Cl
Et 4-Me-Ph Cl	Et 4- Me-Ph Cl
Et 2-MeO-Ph Cl	Et 2- MeO-Ph Cl
Et 3-MeO-Ph Cl	Et 3- MeO-Ph Cl
Et 4-MeO-Ph Cl	Et 4- MeO-Ph Cl
Et 4-Br-Ph Cl	Et 4- Br-Ph Cl
Et 2,6-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 4-CF <sub>3</sub> -Ph Cl	Et 4- CF <sub>3</sub> -Ph Cl
Et 4-Ph-Ph Cl	Et 4- Ph-Ph Cl
Et 4-PhO-Ph Cl	Et 4- PhO-Ph Cl
Et 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 2-F-4-Cl-Ph Cl	Et 2- F-4- Cl-Ph Cl
Et 2-F-4-Me-Ph Cl	Et 2- F-4- Me-Ph Cl
Et 2-F-4-MeO-Ph Cl	Et 2- F-4- MeO-Ph Cl
Et 3-F-4-Cl-Ph Cl	Et 3- F-4- Cl-Ph Cl
Et 3-F-4-Me-Ph Cl	Et 3- F-4- Me-Ph Cl
Et 3-F-4-MeO-Ph Cl	Et 3- F-4- MeO-Ph Cl
Et 4-F-2-Cl-Ph Cl	Et 4- F-2- Cl-Ph Cl
Et 4-F-2-Me-Ph Cl	Et 4- F-2- Me-Ph Cl
Et 4-F-2-MeO-Ph Cl	Et 4- F-2- MeO-Ph Cl
Et 4-F-3-Cl-Ph Cl	Et 4- F-3- Cl-Ph Cl
Et 4-F-3-Me-Ph Cl	Et 4- F-3- Me-Ph Cl
Et 4-F-3-MeO-Ph Cl	Et 4- F-3- MeO-Ph Cl
Et 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 2-Br-Ph Cl	Et 2- Br-Ph Cl
Et 3-Br-Ph Cl	Et 3- Br-Ph Cl
Et 4-EtO-Ph Cl	Et 4- EtO-Ph Cl
Et 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph Cl

Et 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph Cl	Et 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph Cl
Et 2-Cl-3-Me-Ph Cl	Et 2- Cl-3- Me-Ph Cl
Et 2-Cl-4-Me-Ph Cl	Et 2- Cl-4- Me-Ph Cl
Et 3-Cl-4-Me-Ph Cl	Et 3- Cl-4- Me-Ph Cl
Et 4-Cl-2-Me-Ph Cl	Et 4- Cl-2- Me-Ph Cl
Et 4-Cl-3-Me-Ph Cl	Et 4- Cl-3- Me-Ph Cl
Et 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph Cl	Et 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph Cl
Pr Et Cl	Pr Et Cl
Pr n-Pr Cl	Pr n- Pr Cl
Pr i-Pr Cl	Pr i- Pr Cl
Pr s-Bu Cl	Pr s-Bu Cl
Pr t-Bu Cl	Pr t-Bu Cl
Pr CF <sub>3</sub> Cl	Pr CF <sub>3</sub> Cl
Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl	Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl
Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl Cl	Pr 1- Me-3- Cl-Pyrazol-4- yl Cl
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl Cl	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-3- yl Cl
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl Cl	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-4- yl Cl
Pr Ph Cl	Pr Ph Cl
Pr 2-Cl-Ph Cl	Pr 2- Cl-Ph Cl
Pr 4-Cl-Ph Cl	Pr 4- Cl-Ph Cl
Pr 2-F-Ph Cl	Pr 2- F-Ph Cl
Pr 4-F-Ph Cl	Pr 4- F-Ph Cl
Pr 2-Me-Ph Cl	Pr 2- Me-Ph Cl
Pr 4-Me-Ph Cl	Pr 4- Me-Ph Cl
Pr 4-Br-Ph Cl	Pr 4- Br-Ph Cl
Pr 2,6-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Cl	Pr 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Cl
Pr 2-Br-Ph Cl	Pr 2- Br-Ph Cl
Br n-Pr Cl	Br n- Pr Cl
Br i-Pr Cl	Br i- Pr Cl

Br s-Bu Cl	Br s-Bu Cl
Br t-Bu Cl	Br t-Bu Cl
Br CF <sub>3</sub> Cl	Br CF <sub>3</sub> Cl
Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl	Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl
Br Ph Cl	Br Ph Cl
Br 2-Cl-Ph Cl	Br 2- Cl-Ph Cl
Br 4-Cl-Ph Cl	Br 4- Cl-Ph Cl
Br 2-F-Ph Cl	Br 2- F-Ph Cl
Br 4-F-Ph Cl	Br 4- F-Ph Cl
Br 2-Me-Ph Cl	Br 2- Me-Ph Cl
Br 4-Me-Ph Cl	Br 4- Me-Ph Cl
Br 4-Br-Ph Cl	Br 4- Br-Ph Cl
i-Pr i-Pr Cl	i- Pr i- Pr Cl
i-Pr s-Bu Cl	i- Pr s-Bu Cl
i-Pr t-Bu Cl	i- Pr t-Bu Cl
i-Pr CF <sub>3</sub> Cl	i- Pr CF <sub>3</sub> Cl
i-Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl	i- Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Cl
i-Pr Ph Cl	i- Pr Ph Cl
i-Pr 2-Cl-Ph Cl	i- Pr 2- Cl-Ph Cl
i-Pr 4-Cl-Ph Cl	i- Pr 4- Cl-Ph Cl
i-Pr 2-F-Ph Cl	i- Pr 2- F-Ph Cl
i-Pr 4-F-Ph Cl	i- Pr 4- F-Ph Cl
i-Pr 2-Me-Ph Cl	i- Pr 2- Me-Ph Cl
i-Pr 4-Me-Ph Cl	i- Pr 4- Me-Ph Cl
i-Pr 4-Br-Ph Cl	i- Pr 4- Br-Ph Cl
i-Pr 2-Br-Ph Cl	i- Pr 2- Br-Ph Cl
H H Me	H H Me
H Cl Me	HCl Me
H F Me	HF Me
H Br Me	H Br Me
H I Me	H I Me
H Me Me	H Me Me
H Et Me	H Et Me
H n-Pr Me	H n- Pr Me
H i-Pr Me	H i- Pr Me

H n-Bu Me	H n- Bu Me
H i-Bu Me	H i- Bu Me
H s-Bu Me	H s-Bu Me
H t-Bu Me	H t-Bu Me
H n-Pen Me	H n- Pen Me
H 3-Me-n-Bu Me	H 3- Me-n- Bu Me
H n-Hex Me	H n- Hex Me
H Ethenyl Me	H Ethenyl Me
H 1-Propenyl Me	H 1- Propenyl Me
H Ethynyl Me	H Ethynyl Me
H CF <sub>3</sub> Me	HC F <sub>3</sub> Me
H c-Pr Me	H c-Pr Me
H c-Hex Me	H c-Hex Me
H MeO Me	H MeO Me
H t-BuO Me	H t-BuO Me
H CF <sub>3</sub> O Me	HC F <sub>3</sub> OMe
H MeS Me	H MeS Me
H MeSO Me	H MeSO Me
H MeSO <sub>2</sub> Me	H MeSO <sub>2</sub> Me
H NO <sub>2</sub> Me	H NO <sub>2</sub> Me
H NC Me	H NC Me
H CHO Me	HC HOME
H Me <sub>2</sub> N Me	H Me <sub>2</sub> N Me
H PhCH <sub>2</sub> Me	H PhCH <sub>2</sub> Me
H PhCH=CH Me	H PhCH=CH Me
H 4-Cl-PHCH=CH Me	H 4- Cl-PHCH=CH Me
H PhCH=CHCH <sub>2</sub> Me	H PhCH=CHCH <sub>2</sub> Me
H PhCC Me	H PhCC Me
H Ph Me	H Ph Me
H MeNHC(O) Me	H MeNHC (O ) Me
H PhNHC(O) Me	H PhNHC (O ) Me
H EtNHC(O) Me	H EtNHC (O ) Me
H 2-F-PhNHC(O) Me	H 2- F-PhNHC (O ) Me
H 3-F-PhNHC(O) Me	H 3- F-PhNHC (O ) Me
H 4-F-PhNHC(O) Me	H 4- F-PhNHC (O ) Me

H 2-Cl-PhNHC(O) Me	H 2- Cl-PhNHC (O ) Me
H 3-Cl-PhNHC(O) Me	H 3- Cl-PhNHC (O ) Me
H 4-Cl-PhNHC(O) Me	H 4- Cl-PhNHC (O ) Me
H 2-Me-PhNHC(O) Me	H 2- Me-PhNHC (O ) Me
H 3-Me-PhNHC(O) Me	H 3- Me-PhNHC (O ) Me
H 4-Me-PhNHC(O) Me	H 4- Me-PhNHC (O ) Me
H 2-Br-PhNHC(O) Me	H 2- Br-PhNHC (O ) Me
H 3-Br-PhNHC(O) Me	H 3- Br-PhNHC (O ) Me
H 4-Br-PhNHC(O) Me	H 4- Br-PhNHC (O ) Me
H 2-MeO-PhNHC(O) Me	H 2- MeO-PhNHC (O ) Me
H 3-MeO-PhNHC(O) Me	H 3- MeO-PhNHC (O ) Me
H 4-MeO-PhNHC(O) Me	H 4- MeO-PhNHC (O ) Me
H 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) Me	H 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) Me
H MeOC(O) Me	H MeOC (O ) Me
H MeOCH <sub>2</sub> Me	H MeOCH <sub>2</sub> Me
H MeOC(=NOMe) Me	H MeOC (=NOMe ) Me
H MeC(=NOMe) Me	H MeC (=NOMe ) Me
H MeC(O) Me	H MeC (O ) Me
H CH <sub>2</sub> SMe Me	HC H <sub>2</sub> SMe Me
H CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Me	HC H <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Me
H Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> Me	H Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> Me
H ClCH <sub>2</sub> Me	HCl CH <sub>2</sub> Me
H BrCH <sub>2</sub> Me	H BrCH <sub>2</sub> Me
H CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Me	HC F <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Me
H PhC(O)NH Me	H PhC (O ) NH Me
H 1-Naphthyl Me	H 1- Naphthyl Me
H 2-Naphthyl Me	H 2- Naphthyl Me
H 1-Me-Pyrazol-5-yl Me	H 1- Me-Pyrazol-5-yl Me
H 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl Me	H 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl Me
H 2-F-Furan-3-yl Me	H 2- F-Furan-3- yl Me
H Oxazol-2-yl Me	H Oxazol-2- yl Me
H 1,2,4-Oxadiazol-3-yl Me	H 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl Me
H 1,2,4-Thiadiazol-5-yl Me	H 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl Me
H 1,2,4-Triazol-1-yl Me	H 1, 2, 4- Triazol-1- yl Me
H 1,2,3-Triazol-1-yl Me	H 1, 2, 3- Triazol-1- yl Me

H 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl Me	H 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl Me
H 6-MeO-Pyrimidin-2-yl Me	H 6-MeO-Pyrimidin-2- yl Me
H Pyridazin-3-yl Me	H Pyridazin-3- yl Me
H 1,3,5-Triazin-2-yl Me	H 1, 3, 5-Triazin-2- yl Me
H 1,2,4-Triazin-6-yl Me	H 1, 2, 4- Triazin-6-yl Me
H 1-Me-Pyrrol-2-yl Me	H 1- Me-Pyrrol-2- yl Me
H Furan-2-yl Me	HF uran- 2- yl Me
H Thiophen-2-yl Me	H Thiophen-2- yl Me
H Thiazol-5-yl Me	H Thiazol-5-yl Me
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Me	H 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Me
H 3-Me-Isothiazol-5-yl Me	H 3- Me-Isothiazol-5-yl Me
H Isoxazol-5-yl Me	H Isoxazol-5-yl Me
H 1-Me-Imidazol-5-yl Me	H 1- Me-Imidazol-5-yl Me
H 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl Me	H 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl Me
H Pyridin-4-yl Me	H Pyridin-4- yl Me
H Quinoxalin-2-yl Me	H Quinoxalin-2- yl Me
H 6-Cl-Quinoxalin-2-yl Me	H 6-Cl-Quinoxalin-2- yl Me
H 6-F-Quinoxalin-2-yl Me	H 6-F-Quinoxalin-2- yl Me
H 1-Me-Indol-3-yl Me	H 1- Me-Indol-3- yl Me
H Benzothiazol-2-yl Me	H Benzothiazol-2- yl Me
H 5-F-Benzothiazol-2-yl Me	H 5-F-Benzothiazol-2- yl Me
H 6-F-Benzothiazol-2-yl Me	H 6-F-Benzothiazol-2- yl Me
H Quinolin-4-yl Me	H Quinolin-4- yl Me
H Pyrazin-2-yl Me	H Pyrazin-2- yl Me
H 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Me	H 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Me
H Benzofuran-2-yl Me	H Benzofuran-2- yl Me
H Ph Me	H Ph Me
H 2-Cl-Ph Me	H 2- Cl-Ph Me
H 3-Cl-Ph Me	H 3- Cl-Ph Me
H 4-Cl-Ph Me	H 4- Cl-Ph Me
H 2-F-Ph Me	H 2- F-Ph Me
H 3-F-Ph Me	H 3- F-Ph Me
H 4-F-Ph Me	H 4- F-Ph Me
H 2-Me-Ph Me	H 2- Me-Ph Me
H 3-Me-Ph Me	H 3- Me-Ph Me

H 4-Me-Ph Me	H 4- Me-Ph Me
H 2-MeO-Ph Me	H 2- MeO-Ph Me
H 3-MeO-Ph Me	H 3- MeO-Ph Me
H 4-MeO-Ph Me	H 4- MeO-Ph Me
H 4-Br-Ph Me	H 4- Br-Ph Me
H 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph Me	H 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> -Ph Me
H 3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 2-Cl-4-Me-Ph Me	H 2- Cl-4- Me-Ph Me
H 2-MeO-4-Me-Ph Me	H 2- MeO-4- Me-Ph Me
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 4- Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,5-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 5-Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,6-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph Me	H 2, 3, 4, 5, 6-F <sub>5</sub> -Ph Me
H 4-Et-Ph Me	H 4- Et-Ph Me
H 4-i-Pr-Ph Me	H 4- i- Pr-Ph Me
H 4-t-Bu-Ph Me	H 4- t-Bu-Ph Me
H 4-CF <sub>3</sub> -Ph Me	H 4- CF <sub>3</sub> -Ph Me
H 4-i-PrO-Ph Me	H 4- i- PrO-Ph Me
H 4-t-BuO-Ph Me	H 4- t-BuO-Ph Me
H 4-CHF <sub>2</sub> O-Ph Me	H 4- CHF <sub>2</sub> O-Ph Me
H 4-CF <sub>3</sub> O-Ph Me	H 4- CF <sub>3</sub> O-Ph Me
H 4-MeS-Ph Me	H 4- MeS-Ph Me
H 4-CHO-Ph Me	H 4- CHO-Ph Me
H 4-NO <sub>2</sub> -Ph Me	H 4- NO <sub>2</sub> -Ph Me
H 4-CN-Ph Me	H 4- CN-Ph Me
H 4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph Me	H 4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph Me
H 4-MeC(O)-Ph Me	H 4- MeC (O ) -Ph Me
H 4-PhC(O)-Ph Me	H 4- PhC (O ) -Ph Me
H 4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph Me	H 4- MeOCH <sub>2</sub> -Ph Me
H 4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph Me	H 4- MeSCH <sub>2</sub> -Ph Me
H 4-MeC(O)O-Ph Me	H 4- MeC (O ) O-Ph Me
H 4-Ph-Ph Me	H 4- Ph-Ph Me
H 4-PhO-Ph Me	H 4- PhO-Ph Me

H 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
H 2-CF <sub>3</sub> -Ph Me	H 2- CF <sub>3</sub> -Ph Me
H 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Me	H 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Me
H 2-F-6-Cl-Ph Me	H 2- F-6-Cl-Ph Me
H 2-F-6-Me-Ph Me	H 2- F-6-Me-Ph Me
H 2-F-6-MeO-Ph Me	H 2- F-6-MeO-Ph Me
H 2-F-4-Cl-Ph Me	H 2- F-4- Cl-Ph Me
H 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph Me	H 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph Me
H 2-F-4-Me-Ph Me	H 2- F-4- Me-Ph Me
H 2-F-4-MeO-Ph Me	H 2- F-4- MeO-Ph Me
H 3-F-4-Cl-Ph Me	H 3- F-4- Cl-Ph Me
H 3-F-4-Me-Ph Me	H 3- F-4- Me-Ph Me
H 3-F-4-MeO-Ph Me	H 3- F-4- MeO-Ph Me
H 4-F-2-Cl-Ph Me	H 4- F-2- Cl-Ph Me
H 4-F-2-Me-Ph Me	H 4- F-2- Me-Ph Me
H 4-F-2-MeO-Ph Me	H 4- F-2- MeO-Ph Me
H 4-F-3-Cl-Ph Me	H 4- F-3- Cl-Ph Me
H 4-F-3-Me-Ph Me	H 4- F-3- Me-Ph Me
H 4-F-3-MeO-Ph Me	H 4- F-3- MeO-Ph Me
H 2-OH-Ph Me	H 2- OH-Ph Me
H 4-I-Ph Me	H 4- I-Ph Me
H 4-MeOC(O)-Ph Me	H 4- MeOC (O ) -Ph Me
H 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 6-Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 3-CF <sub>3</sub> -Ph Me	H 3- CF <sub>3</sub> -Ph Me
H 2-Br-Ph Me	H 2- Br-Ph Me
H 3-Br-Ph Me	H 3- Br-Ph Me



H 2-MeC(O)-Ph Me	H 2- MeC (O ) -Ph Me
H 4-c-Pr-Ph Me	H 4- c-Pr-Ph Me
H 4-PhS-Ph Me	H 4- PhS-Ph Me
H 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	H 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
H 2-F-4-I-Ph Me	H 2- F-4- I-Ph Me
H 2-F-4-EtO-Ph Me	H 2- F-4- EtO-Ph Me
H 2-F-6-Ph-Ph Me	H 2- F-6-Ph-Ph Me
H 3,4-methylenedioxy-Ph Me	H 3, 4- methylenedioxy-Ph Me
H 3,4-ethylenedioxy-Ph Me	H 3, 4- ethylenedioxy-Ph Me
H 2-F-4-Br-Ph Me	H 2- F-4- Br-Ph Me
H 2-Cl-4-Me-Ph Me	H 2- Cl-4- Me-Ph Me
H 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph Me	H 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph Me
-CH=CH-CH=CH- Me	-CH=CH-CH=CH- Me
-CH=N-CH=CH- Me	-CH=N- CH=CH- Me
-N=CH-CH=CH- Me	-N=CH-CH=CH- Me
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - Me	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - Me
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - Me	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - Me
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - Me	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - Me
-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - Me	-CO- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - Me
-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> Ph)-CH <sub>2</sub> - Me	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> Ph)-CH <sub>2</sub> - Me
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(Me)-CH <sub>2</sub> - Me	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(Me)-CH <sub>2</sub> - Me
-CH=CH-CH=C(OMe)- Me	-CH=CH-CH=C (OMe ) -Me
Me Cl Me	Me Cl Me
Me Cl Me	Me Cl Me
Me F Me	Me F Me
Me Br Me	Me Br Me
Me I Me	Me I Me

Me Me Me	Me Me Me
Me Et Me	Me Et Me
Me n-Pr Me	Me n- Pr Me
Me i-Pr Me	Me i- Pr Me
Me n-Bu Me	Me n- Bu Me
Me i-Bu Me	Me i- Bu Me
Me s-Bu Me	Me s-Bu Me
Me t-Bu Me	Me t-Bu Me
Me n-Pen Me	Me n- Pen Me
Me 3-Me-n-Bu Me	Me 3- Me-n- Bu Me
Me n-Hex Me	Me n- Hex Me
Me Ethenyl Me	Me Ethenyl Me
Me 1-Propenyl Me	Me 1- Propenyl Me
Me Ethynyl Me	Me Ethynyl Me
Me CF <sub>3</sub> Me	Me CF <sub>3</sub> Me
Me c-Pr Me	Me c-Pr Me
Me c-Hex Me	Me c-Hex Me
Me MeO Me	Me MeO Me
Me t-BuO Me	Me t-BuO Me
Me CF <sub>3</sub> O Me	Me CF <sub>3</sub> OMe
Me MeS Me	Me MeS Me
Me MeSO Me	Me MeSO Me
Me MeSO <sub>2</sub> Me	Me MeSO <sub>2</sub> Me
Me NO <sub>2</sub> Me	Me NO <sub>2</sub> Me
Me NC Me	Me NC Me
Me CHO Me	Me CHO Me
Me Me <sub>2</sub> N Me	Me Me <sub>2</sub> N Me
Me PhCH <sub>2</sub> Me	Me PhCH <sub>2</sub> Me
Me PhCH=CH Me	Me PhCH=CH Me
Me 4-Cl-PHCH=CH Me	Me 4- Cl-PHCH=CH Me
Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> Me	Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> Me
Me PhCC Me	Me PhCC Me
Me Ph Me	Me Ph Me
Me MeNHC(O) Me	Me MeNHC (O ) Me
Me PhNHC(O) Me	Me PhNHC (O ) Me

Me EtNHC(O) Me	Me EtNHC (O ) Me
Me 2-F-PhNHC(O) Me	Me 2- F-PhNHC (O ) Me
Me 3-F-PhNHC(O) Me	Me 3- F-PhNHC (O ) Me
Me 4-F-PhNHC(O) Me	Me 4- F-PhNHC (O ) Me
Me 2-Cl-PhNHC(O) Me	Me 2- Cl-PhNHC (O ) Me
Me 3-Cl-PhNHC(O) Me	Me 3- Cl-PhNHC (O ) Me
Me 4-Cl-PhNHC(O) Me	Me 4- Cl-PhNHC (O ) Me
Me 2-Me-PhNHC(O) Me	Me 2- Me-PhNHC (O ) Me
Me 3-Me-PhNHC(O) Me	Me 3- Me-PhNHC (O ) Me
Me 4-Me-PhNHC(O) Me	Me 4- Me-PhNHC (O ) Me
Me 2-Br-PhNHC(O) Me	Me 2- Br-PhNHC (O ) Me
Me 3-Br-PhNHC(O) Me	Me 3- Br-PhNHC (O ) Me
Me 4-Br-PhNHC(O) Me	Me 4- Br-PhNHC (O ) Me
Me 2-MeO-PhNHC(O) Me	Me 2- MeO-PhNHC (O ) Me
Me 3-MeO-PhNHC(O) Me	Me 3- MeO-PhNHC (O ) Me
Me 4-MeO-PhNHC(O) Me	Me 4- MeO-PhNHC (O ) Me
Me 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) Me	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) Me
Me MeOC(O) Me	Me MeOC (O ) Me
Me MeOCH <sub>2</sub> Me	Me MeOCH <sub>2</sub> Me
Me MeOC(=NOMe) Me	Me MeOC (=NOMe ) Me
Me MeC(=NOMe) Me	Me MeC (=NOMe ) Me
Me MeC(O) Me	Me MeC (O ) Me
Me CH <sub>2</sub> SMe Me	Me CH <sub>2</sub> SMe Me
Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Me	Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph Me
Me Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> Me	Me Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> Me
Me ClCH <sub>2</sub> Me	Me ClCH <sub>2</sub> Me
Me BrCH <sub>2</sub> Me	Me BrCH <sub>2</sub> Me
Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Me	Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> Me
Me PhC(O)NH Me	Me PhC (O ) NH Me
Me 1-Naphthyl Me	Me 1- Naphthyl Me
Me 2-Naphthyl Me	Me 2- Naphthyl Me
Me 1-Me-Pyrazol-5-yl Me	Me 1- Me-Pyrazol-5-yl Me
Me 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl Me	Me 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl Me
Me 2-F-Furan-3-yl Me	Me 2- F-Furan-3- yl Me
Me Oxazol-2-yl Me	Me Oxazol-2- yl Me

Me 1,2,4-Oxadiazol-3-yl Me	Me 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl Me
Me 1,2,4-Thiadiazol-5-yl Me	Me 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl Me
Me 1,2,4-Triazol-1-yl Me	Me 1, 2, 4- Triazol-1- yl Me
Me 1,2,3-Triazol-1-yl Me	Me 1, 2, 3- Triazol-1- yl Me
Me 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl Me	Me 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl Me
Me 6-MeO-Pyrimidin-2-yl Me	Me 6-MeO-Pyrimidin-2- yl Me
Me Pyridazin-3-yl Me	Me Pyridazin-3- yl Me
Me 1,3,5-Triazin-2-yl Me	Me 1, 3, 5-Triazin-2- yl Me
Me 1,2,4-Triazin-6-yl Me	Me 1, 2, 4- Triazin-6-yl Me
Me 1-Me-Pyrrol-2-yl Me	Me 1- Me-Pyrrol-2- yl Me
Me Furan-2-yl Me	Me Furan-2- yl Me
Me Thiophen-2-yl Me	Me Thiophen-2- yl Me
Me Thiazol-5-yl Me	Me Thiazol-5-yl Me
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl Me	Me 2, 4- Me<sub>2</sub>-Oxazol-5-yl Me
Me 3-Me-Isythiazol-5-yl Me	Me 3- Me-Isythiazol-5-yl Me
Me Isoxazol-5-yl Me	Me Isoxazol-5-yl Me
Me 1-Me-Imidazol-5-yl Me	Me 1- Me-Imidazol-5-yl Me
Me 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl Me	Me 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl Me
Me Pyridin-4-yl Me	Me Pyridin-4- yl Me
Me Quinoxalin-2-yl Me	Me Quinoxalin-2- yl Me
Me 6-Cl-Quinoxalin-2-yl Me	Me 6-Cl-Quinoxalin-2- yl Me
Me 6-F-Quinoxalin-2-yl Me	Me 6-F-Quinoxalin-2- yl Me
Me 1-Me-Indol-3-yl Me	Me 1- Me-Indol-3- yl Me
Me Benzothiazol-2-yl Me	Me Benzothiazol-2- yl Me
Me 5-F-Benzothiazol-2-yl Me	Me 5-F-Benzothiazol-2- yl Me
Me 6-F-Benzothiazol-2-yl Me	Me 6-F-Benzothiazol-2- yl Me
Me Quinolin-4-yl Me	Me Quinolin-4- yl Me
Me Pyrazin-2-yl Me	Me Pyrazin-2- yl Me
Me 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl Me	Me 4- CClF<sub>2</sub>-Pyrimidin-5-yl Me
Me Benzofuran-2-yl Me	Me Benzofuran-2- yl Me
Me Ph Me	Me Ph Me
Me 2-Cl-Ph Me	Me 2- Cl-Ph Me
Me 3-Cl-Ph Me	Me 3- Cl-Ph Me
Me 4-Cl-Ph Me	Me 4- Cl-Ph Me
Me 2-F-Ph Me	Me 2- F-Ph Me

Me 3-F-Ph Me

Me 4-F-Ph Me

Me 2-Me-Ph Me

Me 3-Me-Ph Me

Me 4-Me-Ph Me

Me 2-MeO-Ph Me

Me 3-MeO-Ph Me

Me 4-MeO-Ph Me

Me 4-Br-Ph Me

Me 2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph Me

Me 3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph Me

Me 3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2-Cl-4-Me-Ph Me

Me 2-MeO-4-Me-Ph Me

Me 2,4-Me<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2,5-Me<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2,6-F<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2,3,4,5,6-F<sub>5</sub>-Ph Me

Me 4-Et-Ph Me

Me 4-i-Pr-Ph Me

Me 4-t-Bu-Ph Me

Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Me

Me 4-i-PrO-Ph Me

Me 4-t-BuO-Ph Me

Me 4-CHF<sub>2</sub>O-Ph Me

Me 4-CF<sub>3</sub>O-Ph Me

Me 4-MeS-Ph Me

Me 4-CHO-Ph Me

Me 4-NO<sub>2</sub>-Ph Me

Me 4-CN-Ph Me

Me 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph Me

Me 4-MeC(O)-Ph Me

Me 4-PhC(O)-Ph Me

Me 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph Me

Me 3- F-Ph Me

Me 4- F-Ph Me

Me 2- Me-Ph Me

Me 3- Me-Ph Me

Me 4- Me-Ph Me

Me 2- MeO-Ph Me

Me 3- MeO-Ph Me

Me 4- MeO-Ph Me

Me 4- Br-Ph Me

Me 2, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph Me

Me 3, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2, 4, 6-Cl<sub>3</sub>-Ph Me

Me 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph Me

Me 2- Cl-4- Me-Ph Me

Me 2- MeO-4- Me-Ph Me

Me 2, 4- Me<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2, 5-Me<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph Me

Me 2, 3, 4, 5, 6-F<sub>5</sub>-Ph Me

Me 4- Et-Ph Me

Me 4- i- Pr-Ph Me

Me 4- t-Bu-Ph Me

Me 4- CF<sub>3</sub>-Ph Me

Me 4- i- PrO-Ph Me

Me 4- t-BuO-Ph Me

Me 4- CHF <sub>2</sub>O-Ph Me

Me 4- CF<sub>3</sub>O-Ph Me

Me 4- MeS-Ph Me

Me 4- CHO-Ph Me

Me 4- NO<sub>2</sub>-Ph Me

Me 4- CN-Ph Me

Me 4- PhCH<sub>2</sub>O-Ph Me

Me 4- MeC (O ) -Ph Me

Me 4- PhC (O ) -Ph Me

Me 4- MeOCH<sub>2</sub>-Ph Me

Me 4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph Me	Me 4- MeSCH <sub>2</sub> -Ph Me
Me 4-MeC(O)O-Ph Me	Me 4- MeC (O ) O-Ph Me
Me 4-Ph-Ph Me	Me 4- Ph-Ph Me
Me 4-PhO-Ph Me	Me 4- PhO-Ph Me
Me 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2-CF <sub>3</sub> -Ph Me	Me 2- CF <sub>3</sub> -Ph Me
Me 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Me	Me 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph Me
Me 2-F-6-Cl-Ph Me	Me 2- F-6-Cl-Ph Me
Me 2-F-6-Me-Ph Me	Me 2- F-6-Me-Ph Me
Me 2-F-6-MeO-Ph Me	Me 2- F-6-MeO-Ph Me
Me 2-F-4-Cl-Ph Me	Me 2- F-4- Cl-Ph Me
Me 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph Me	Me 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph Me
Me 2-F-4-Me-Ph Me	Me 2- F-4- Me-Ph Me
Me 2-F-4-MeO-Ph Me	Me 2- F-4- MeO-Ph Me
Me 3-F-4-Cl-Ph Me	Me 3- F-4- Cl-Ph Me
Me 3-F-4-Me-Ph Me	Me 3- F-4- Me-Ph Me
Me 3-F-4-MeO-Ph Me	Me 3- F-4- MeO-Ph Me
Me 4-F-2-Cl-Ph Me	Me 4- F-2- Cl-Ph Me
Me 4-F-2-Me-Ph Me	Me 4- F-2- Me-Ph Me
Me 4-F-2-MeO-Ph Me	Me 4- F-2- MeO-Ph Me
Me 4-F-3-Cl-Ph Me	Me 4- F-3- Cl-Ph Me
Me 4-F-3-Me-Ph Me	Me 4- F-3- Me-Ph Me
Me 4-F-3-MeO-Ph Me	Me 4- F-3- MeO-Ph Me
Me 2-OH-Ph Me	Me 2- OH-Ph Me
Me 4-I-Ph Me	Me 4- I-Ph Me
Me 4-MeOC(O)-Ph Me	Me 4- MeOC (O ) -Ph Me
Me 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 6-Me <sub>2</sub> -Ph Me

Me 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3-CF <sub>3</sub> -Ph Me	Me 3- CF <sub>3</sub> -Ph Me
Me 2-Br-Ph Me	Me 2- Br-Ph Me
Me 3-Br-Ph Me	Me 3- Br-Ph Me
Me 2-MeC(O)-Ph Me	Me 2- MeC (O ) -Ph Me
Me 4-c-Pr-Ph Me	Me 4- c-Pr-Ph Me
Me 4-PhS-Ph Me	Me 4- PhS-Ph Me
Me 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Me 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Me 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Me 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Me 2-F-4-I-Ph Me	Me 2- F-4- I-Ph Me
Me 2-F-4-EtO-Ph Me	Me 2- F-4- EtO-Ph Me
Me 2-F-6-Ph-Ph Me	Me 2- F-6-Ph-Ph Me
Me 3,4-methylenedioxy-Ph Me	Me 3, 4- methylenedioxy-Ph Me
Me 3,4-ethylenedioxy-Ph Me	Me 3, 4- ethylenedioxy-Ph Me
Me 2-F-4-Br-Ph Me	Me 2- F-4- Br-Ph Me
Me 2-Cl-4-Me-Ph Me	Me 2- Cl-4- Me-Ph Me
Me 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph Me	Me 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph Me
Et Et Me	Et Et Me
Et n-Pr Me	Et n- Pr Me
Et i-Pr Me	Et i- Pr Me
Et n-Bu Me	Et n- Bu Me
Et s-Bu Me	Et s-Bu Me
Et t-Bu Me	Et t-Bu Me
Et CF <sub>3</sub> Me	Et CF <sub>3</sub> Me
Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me	Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me
Et 1-Naphthyl Me	Et 1- Naphthyl Me
Et 2-Naphthyl Me	Et 2- Naphthyl Me
Et Ph Me	Et Ph Me
Et 2-Cl-Ph Me	Et 2- Cl-Ph Me
Et 4-Cl-Ph Me	Et 4- Cl-Ph Me

Et 2-F-Ph Me	Et 2- F-Ph Me
Et 4-F-Ph Me	Et 4- F-Ph Me
Et 2-Me-Ph Me	Et 2- Me-Ph Me
Et 3-Me-Ph Me	Et 3- Me-Ph Me
Et 4-Me-Ph Me	Et 4- Me-Ph Me
Et 2-MeO-Ph Me	Et 2- MeO-Ph Me
Et 3-MeO-Ph Me	Et 3- MeO-Ph Me
Et 4-MeO-Ph Me	Et 4- MeO-Ph Me
Et 4-Br-Ph Me	Et 4- Br-Ph Me
Et 2,6-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 4-CF <sub>3</sub> -Ph Me	Et 4- CF <sub>3</sub> -Ph Me
Et 4-Ph-Ph Me	Et 4- Ph-Ph Me
Et 4-PhO-Ph Me	Et 4- PhO-Ph Me
Et 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Et 2-F-4-Cl-Ph Me	Et 2- F-4- Cl-Ph Me
Et 2-F-4-Me-Ph Me	Et 2- F-4- Me-Ph Me
Et 2-F-4-MeO-Ph Me	Et 2- F-4- MeO-Ph Me
Et 3-F-4-Cl-Ph Me	Et 3- F-4- Cl-Ph Me
Et 3-F-4-Me-Ph Me	Et 3- F-4- Me-Ph Me
Et 3-F-4-MeO-Ph Me	Et 3- F-4- MeO-Ph Me
Et 4-F-2-Cl-Ph Me	Et 4- F-2- Cl-Ph Me
Et 4-F-2-Me-Ph Me	Et 4- F-2- Me-Ph Me
Et 4-F-2-MeO-Ph Me	Et 4- F-2- MeO-Ph Me
Et 4-F-3-Cl-Ph Me	Et 4- F-3- Cl-Ph Me
Et 4-F-3-Me-Ph Me	Et 4- F-3- Me-Ph Me
Et 4-F-3-MeO-Ph Me	Et 4- F-3- MeO-Ph Me
Et 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph Me
Et 2-Br-Ph Me	Et 2- Br-Ph Me
Et 3-Br-Ph Me	Et 3- Br-Ph Me
Et 4-EtO-Ph Me	Et 4- EtO-Ph Me
Et 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Et 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph Me



Et 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Et 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph Me
Et 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph Me	Et 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph Me
Et 2-Cl-3-Me-Ph Me	Et 2- Cl-3- Me-Ph Me
Et 2-Cl-4-Me-Ph Me	Et 2- Cl-4- Me-Ph Me
Et 3-Cl-4-Me-Ph Me	Et 3- Cl-4- Me-Ph Me
Et 4-Cl-2-Me-Ph Me	Et 4- Cl-2- Me-Ph Me
Et 4-Cl-3-Me-Ph Me	Et 4- Cl-3- Me-Ph Me
Et 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph Me	Et 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph Me
Pr Et Me	Pr Et Me
Pr n-Pr Me	Pr n- Pr Me
Pr i-Pr Me	Pr i- Pr Me
Pr s-Bu Me	Pr s-Bu Me
Pr t-Bu Me	Pr t-Bu Me
Pr CF <sub>3</sub> Me	Pr CF <sub>3</sub> Me
Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me	Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me
Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl Me	Pr 1- Me-3- Cl-Pyrazol-4- yl Me
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl Me	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-3- yl Me
Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl Me	Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-4- yl Me
Pr Ph Me	Pr Ph Me
Pr 2-Cl-Ph Me	Pr 2- Cl-Ph Me
Pr 4-Cl-Ph Me	Pr 4- Cl-Ph Me
Pr 2-F-Ph Me	Pr 2- F-Ph Me
Pr 4-F-Ph Me	Pr 4- F-Ph Me
Pr 2-Me-Ph Me	Pr 2- Me-Ph Me
Pr 4-Me-Ph Me	Pr 4- Me-Ph Me
Pr 4-Br-Ph Me	Pr 4- Br-Ph Me
Pr 2,6-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 2,3-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 2,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 3,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 3,5-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 2,4-F <sub>2</sub> -Ph Me	Pr 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph Me
Pr 2-Br-Ph Me	Pr 2- Br-Ph Me
Br n-Pr Me	Br n- Pr Me
Br i-Pr Me	Br i- Pr Me

Br s-Bu Me	Br s-Bu Me
Br t-Bu Me	Br t-Bu Me
Br CF <sub>3</sub> Me	Br CF <sub>3</sub> Me
Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me	Br CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me
Br Ph Me	Br Ph Me
Br 2-Cl-Ph Me	Br 2- Cl-Ph Me
Br 4-Cl-Ph Me	Br 4- Cl-Ph Me
Br 2-F-Ph Me	Br 2- F-Ph Me
Br 4-F-Ph Me	Br 4- F-Ph Me
Br 2-Me-Ph Me	Br 2- Me-Ph Me
Br 4-Me-Ph Me	Br 4- Me-Ph Me
Br 4-Br-Ph Me	Br 4- Br-Ph Me
i-Pr i-Pr Me	i- Pr i- Pr Me
i-Pr s-Bu Me	i- Pr s-Bu Me
i-Pr t-Bu Me	i- Pr t-Bu Me
i-Pr CF <sub>3</sub> Me	i- Pr CF <sub>3</sub> Me
i-Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me	i- Pr CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me
i-Pr Ph Me	i- Pr Ph Me
i-Pr 2-Cl-Ph Me	i- Pr 2- Cl-Ph Me
i-Pr 4-Cl-Ph Me	i- Pr 4- Cl-Ph Me
i-Pr 2-F-Ph Me	i- Pr 2- F-Ph Me
i-Pr 4-F-Ph Me	i- Pr 4- F-Ph Me
i-Pr 2-Me-Ph Me	i- Pr 2- Me-Ph Me
i-Pr 4-Me-Ph Me	i- Pr 4- Me-Ph Me
i-Pr 4-Br-Ph Me	i- Pr 4- Br-Ph Me
i-Pr 2-Br-Ph Me	i- Pr 2- Br-Ph Me
H H CF <sub>3</sub>	H HC F <sub>3</sub>
H Cl CF <sub>3</sub>	HCl CF <sub>3</sub>
H F CF <sub>3</sub>	HFC F <sub>3</sub>
H Br CF <sub>3</sub>	H Br CF <sub>3</sub>
H I CF <sub>3</sub>	H ICF <sub>3</sub>
H Me CF <sub>3</sub>	H Me CF <sub>3</sub>
H Et CF <sub>3</sub>	H Et CF <sub>3</sub>
H n-Pr CF <sub>3</sub>	H n- Pr CF <sub>3</sub>
H i-Pr CF <sub>3</sub>	H i- Pr CF <sub>3</sub>

H n-Bu CF <sub>3</sub>	H n- Bu CF <sub>3</sub>
H i-Bu CF <sub>3</sub>	H i- Bu CF <sub>3</sub>
H s-Bu CF <sub>3</sub>	H s-Bu CF <sub>3</sub>
H t-Bu CF <sub>3</sub>	H t-Bu CF <sub>3</sub>
H n-Pen CF <sub>3</sub>	H n- Pen CF <sub>3</sub>
H 3-Me-n-Bu CF <sub>3</sub>	H 3- Me-n- Bu CF <sub>3</sub>
H n-Hex CF <sub>3</sub>	H n- Hex CF <sub>3</sub>
H Ethenyl CF <sub>3</sub>	H Ethenyl CF <sub>3</sub>
H 1-Propenyl CF <sub>3</sub>	H 1- Propenyl CF <sub>3</sub>
H Ethynyl CF <sub>3</sub>	H Ethynyl CF <sub>3</sub>
H CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	HC F <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
H c-Pr CF <sub>3</sub>	H c-Pr CF <sub>3</sub>
H c-Hex CF <sub>3</sub>	H c-Hex CF <sub>3</sub>
H MeO CF <sub>3</sub>	H MeO CF <sub>3</sub>
H t-BuO CF <sub>3</sub>	H t-BuO CF <sub>3</sub>
H CF <sub>3</sub> O CF <sub>3</sub>	HC F <sub>3</sub> O CF <sub>3</sub>
H MeS CF <sub>3</sub>	H MeS CF <sub>3</sub>
H MeSO CF <sub>3</sub>	H MeSO CF <sub>3</sub>
H MeSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H MeSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H NO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H NO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H NC CF <sub>3</sub>	H NC CF <sub>3</sub>
H CHO CF <sub>3</sub>	HC HO CF <sub>3</sub>
H Me <sub>2</sub> N CF <sub>3</sub>	H Me <sub>2</sub> N CF <sub>3</sub>
H PhCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H PhCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H PhCH=CH CF <sub>3</sub>	H PhCH=CHC F <sub>3</sub>
H 4-Cl-PHCH=CH CF <sub>3</sub>	H 4- Cl-PHCH=CHC F <sub>3</sub>
H PhCH=CHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H PhCH=CHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H PhCC CF <sub>3</sub>	H PhCC CF <sub>3</sub>
H Ph CF <sub>3</sub>	H Ph CF <sub>3</sub>
H MeNHC(O) CF <sub>3</sub>	H MeNHC ( O ) CF <sub>3</sub>
H PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H PhNHC ( O ) CF <sub>3</sub>
H EtNHC(O) CF <sub>3</sub>	H EtNHC ( O ) CF <sub>3</sub>
H 2-F-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2- F-PhNHC ( O ) CF <sub>3</sub>
H 3-F-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 3- F-PhNHC ( O ) CF <sub>3</sub>
H 4-F-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 4- F-PhNHC ( O ) CF <sub>3</sub>

H 2-Cl-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2- Cl-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 3-Cl-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 3- Cl-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 4-Cl-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 4- Cl-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 2-Me-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2- Me-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 3-Me-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 3- Me-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 4-Me-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 4- Me-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 2-Br-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2- Br-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 3-Br-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 3- Br-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 4-Br-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 4- Br-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 2-MeO-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2- MeO-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 3-MeO-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 3- MeO-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 4-MeO-PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 4- MeO-PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	H 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>
H MeOC(O) CF <sub>3</sub>	H MeOC (O ) CF <sub>3</sub>
H MeOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H MeOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H MeOC(=NOMe) CF <sub>3</sub>	H MeOC (=NOMe ) CF <sub>3</sub>
H MeC(=NOMe) CF <sub>3</sub>	H MeC (=NOMe ) CF <sub>3</sub>
H MeC(O) CF <sub>3</sub>	H MeC (O ) CF <sub>3</sub>
H CH <sub>2</sub> SMe CF <sub>3</sub>	HC H <sub>2</sub> SMe CF <sub>3</sub>
H CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph CF <sub>3</sub>	HC H <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph CF <sub>3</sub>
H Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H ClCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	HCl CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H BrCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H BrCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	HC F <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H PhC(O)NH CF <sub>3</sub>	H PhC (O ) NH CF <sub>3</sub>
H 1-Naphthyl CF <sub>3</sub>	H 1- Naphthyl CF <sub>3</sub>
H 2-Naphthyl CF <sub>3</sub>	H 2- Naphthyl CF <sub>3</sub>
H 1-Me-Pyrazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 1- Me-Pyrazol-5-yl CF <sub>3</sub>
H 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl CF <sub>3</sub>
H 2-F-Furan-3-yl CF <sub>3</sub>	H 2- F-Furan-3- yl CF <sub>3</sub>
H Oxazol-2-yl CF <sub>3</sub>	H Oxazol-2- yl CF <sub>3</sub>
H 1,2,4-Oxadiazol-3-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl CF <sub>3</sub>
H 1,2,4-Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>
H 1,2,4-Triazol-1-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 4- Triazol-1- yl CF <sub>3</sub>
H 1,2,3-Triazol-1-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 3- Triazol-1- yl CF <sub>3</sub>

H 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 6-MeO-Pyrimidin-2-yl CF <sub>3</sub>	H 6-MeO-Pyrimidin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Pyridazin-3-yl CF <sub>3</sub>	H Pyridazin-3- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 1,3,5-Triazin-2-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 3, 5-Triazin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 1,2,4-Triazin-6-yl CF <sub>3</sub>	H 1, 2, 4- Triazin-6-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 1-Me-Pyrrol-2-yl CF <sub>3</sub>	H 1- Me-Pyrrol-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Furan-2-yl CF <sub>3</sub>	HF uran- 2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Thiophen-2-yl CF <sub>3</sub>	H Thiophen-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Thiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H Thiazol-5-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 2, 4- Me <sub>&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Oxazol-5-yl CF<sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub></sub>
H 3-Me-Isothiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 3- Me-Isothiazol-5-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Isoxazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H Isoxazol-5-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 1-Me-Imidazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 1- Me-Imidazol-5-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	H 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Pyridin-4-yl CF <sub>3</sub>	H Pyridin-4- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	H Quinoxalin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 6-Cl-Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	H 6-Cl-Quinoxalin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 6-F-Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	H 6-F-Quinoxalin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 1-Me-Indol-3-yl CF <sub>3</sub>	H 1- Me-Indol-3- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	H Benzothiazol-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 5-F-Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	H 5-F-Benzothiazol-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 6-F-Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	H 6-F-Benzothiazol-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Quinolin-4-yl CF <sub>3</sub>	H Quinolin-4- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Pyrazin-2-yl CF <sub>3</sub>	H Pyrazin-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl CF <sub>3</sub>	H 4- CClF <sub>&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Pyrimidin-5-yl CF<sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub></sub>
H Benzofuran-2-yl CF <sub>3</sub>	H Benzofuran-2- yl CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H Ph CF <sub>3</sub>	H Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 2-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- Cl-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 3-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- Cl-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- Cl-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 2-F-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 3-F-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- F-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 4-F-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 2-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- Me-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>
H 3-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- Me-Ph CF <sub>&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;</sub>

H 4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 3-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-Br-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- Br-Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-Cl-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- Cl-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-MeO-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- MeO-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,6-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 3, 4, 5, 6-F <sub>5</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-Et-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- Et-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-i-Pr-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- i- Pr-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-t-Bu-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- t-Bu-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 4- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-i-PrO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- i- PrO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-t-BuO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- t-BuO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-CHF <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- CHF <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-CF <sub>3</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- CF <sub>3</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeS-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeS-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-CHO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- CHO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-NO <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 4- NO <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-CN-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- CN-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeC (O ) -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-PhC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- PhC (O ) -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeOCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeSCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeC(O)O-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeC (O ) O-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-Ph-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- Ph-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-PhO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- PhO-Ph CF <sub>3</sub>

H 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,3-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-6-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-6-Cl-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-6-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-6-Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-6-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-6-MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 3-F-4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- F-4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
H 3-F-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- F-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 3-F-4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- F-4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-2-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-2- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-2-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-2- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-2-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-2- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-3-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-3- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-3-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-3- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-F-3-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- F-3- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-OH-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- OH-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-I-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- I-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-MeOC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- MeOC (O ) -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 6-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-Br-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- Br-Ph CF <sub>3</sub>
H 3-Br-Ph CF <sub>3</sub>	H 3- Br-Ph CF <sub>3</sub>

H 2-MeC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- MeC (O ) -Ph CF <sub>3</sub>
H 4-c-Pr-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- c-Pr-Ph CF <sub>3</sub>
H 4-PhS-Ph CF <sub>3</sub>	H 4- PhS-Ph CF <sub>3</sub>
H 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-I-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- I-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-EtO-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- EtO-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-6-Ph-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-6-Ph-Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-methylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- methylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>
H 3,4-ethylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>	H 3, 4- ethylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-F-4-Br-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- F-4- Br-Ph CF <sub>3</sub>
H 2-Cl-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	H 2- Cl-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
H 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	H 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
-CH=CH-CH=CH- CF <sub>3</sub>	-CH=CH-CH=CH- CF <sub>3</sub>
-CH=N-CH=CH- CF <sub>3</sub>	-CH=N- CH=CH- CF <sub>3</sub>
-N=CH-CH=CH- CF <sub>3</sub>	-N=CH-CH=CH- CF <sub>3</sub>
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CF <sub>3</sub>	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ) - CF <sub>3</sub>
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - CF <sub>3</sub>	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ) - CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>
-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CF <sub>3</sub>	-CO- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ) - CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> Ph)-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> Ph)-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(Me)-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(Me)-CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub>
-CH=CH-CH=C(OMe)- CF <sub>3</sub>	-CH=CH-CH=C (OMe ) -CF <sub>3</sub>
Me Cl CF <sub>3</sub>	Me Cl CF <sub>3</sub>
Me Cl CF <sub>3</sub>	Me Cl CF <sub>3</sub>
Me F CF <sub>3</sub>	Me F CF <sub>3</sub>
Me Br CF <sub>3</sub>	Me Br CF <sub>3</sub>
Me I CF <sub>3</sub>	Me ICF <sub>3</sub>



Me Me CF <sub>3</sub>	Me Me CF <sub>3</sub>
Me Et CF <sub>3</sub>	Me Et CF <sub>3</sub>
Me n-Pr CF <sub>3</sub>	Me n- Pr CF <sub>3</sub>
Me i-Pr CF <sub>3</sub>	Me i- Pr CF <sub>3</sub>
Me n-Bu CF <sub>3</sub>	Me n- Bu CF <sub>3</sub>
Me i-Bu CF <sub>3</sub>	Me i- Bu CF <sub>3</sub>
Me s-Bu CF <sub>3</sub>	Me s-Bu CF <sub>3</sub>
Me t-Bu CF <sub>3</sub>	Me t-Bu CF <sub>3</sub>
Me n-Pen CF <sub>3</sub>	Me n- Pen CF <sub>3</sub>
Me 3-Me-n-Bu CF <sub>3</sub>	Me 3- Me-n- Bu CF <sub>3</sub>
Me n-Hex CF <sub>3</sub>	Me n- Hex CF <sub>3</sub>
Me Ethenyl CF <sub>3</sub>	Me Ethenyl CF <sub>3</sub>
Me 1-Propenyl CF <sub>3</sub>	Me 1- Propenyl CF <sub>3</sub>
Me Ethynyl CF <sub>3</sub>	Me Ethynyl CF <sub>3</sub>
Me CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	Me CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Me c-Pr CF <sub>3</sub>	Me c-Pr CF <sub>3</sub>
Me c-Hex CF <sub>3</sub>	Me c-Hex CF <sub>3</sub>
Me MeO CF <sub>3</sub>	Me MeO CF <sub>3</sub>
Me t-BuO CF <sub>3</sub>	Me t-BuO CF <sub>3</sub>
Me CF <sub>3</sub> O CF <sub>3</sub>	Me CF <sub>3</sub> O CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Me MeS CF <sub>3</sub>	Me MeS CF <sub>3</sub>
Me MeSO CF <sub>3</sub>	Me MeSO CF <sub>3</sub>
Me MeSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me MeSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Me NO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me NO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Me NC CF <sub>3</sub>	Me NC CF <sub>3</sub>
Me CHO CF <sub>3</sub>	Me CHO CF <sub>3</sub>
Me Me <sub>2</sub> N CF <sub>3</sub>	Me Me <sub>2</sub> N CF <sub>3</sub>
Me PhCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me PhCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me PhCH=CH CF <sub>3</sub>	Me PhCH=CHC F <sub>3</sub>
Me 4-Cl-PHCH=CH CF <sub>3</sub>	Me 4- Cl-PHCH=CHC F <sub>3</sub>
Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me PhCC CF <sub>3</sub>	Me PhCC CF <sub>3</sub>
Me Ph CF <sub>3</sub>	Me Ph CF <sub>3</sub>
Me MeNHC(O) CF <sub>3</sub>	Me MeNHC (O ) CF <sub>3</sub>
Me PhNHC(O) CF <sub>3</sub>	Me PhNHC (O ) CF <sub>3</sub>

Me EtNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2-F-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 3-F-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 4-F-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2-Cl-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 3-Cl-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 4-Cl-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2-Me-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 3-Me-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 4-Me-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2-Br-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 3-Br-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 4-Br-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2-MeO-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 3-MeO-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 4-MeO-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me 2,6-F<sub>2</sub>-PhNHC(O) CF<sub>3</sub>Me MeOC(O) CF<sub>3</sub>Me MeOCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me MeOC(=NOMe) CF<sub>3</sub>Me MeC(=NOMe) CF<sub>3</sub>Me MeC(O) CF<sub>3</sub>Me CH<sub>2</sub>SMe CF<sub>3</sub>Me CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>Ph CF<sub>3</sub>Me Pyrazol-1-ylCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me ClCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me BrCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me PhC(O)NH CF<sub>3</sub>Me 1-Naphthyl CF<sub>3</sub>Me 2-Naphthyl CF<sub>3</sub>Me 1-Me-Pyrazol-5-yl CF<sub>3</sub>Me 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl CF<sub>3</sub>Me 2-F-Furan-3-yl CF<sub>3</sub>Me Oxazol-2-yl CF<sub>3</sub>Me EtNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2- F-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 3- F-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 4- F-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2- Cl-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 3- Cl-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 4- Cl-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2- Me-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 3- Me-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 4- Me-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2- Br-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 3- Br-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 4- Br-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2- MeO-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 3- MeO-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 4- MeO-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me 2, 6-F<sub>2</sub>-PhNHC (O ) CF<sub>3</sub>Me MeOC (O ) CF<sub>3</sub>Me MeOCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me MeOC (=NOMe ) CF<sub>3</sub>Me MeC (=NOMe ) CF<sub>3</sub>Me MeC (O ) CF<sub>3</sub>Me CH<sub>2</sub>SMe CF<sub>3</sub>Me CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>Ph CF<sub>3</sub>Me Pyrazol-1- ylCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me ClCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me BrCH<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>Me PhC (O ) NH CF<sub>3</sub>Me 1- Naphthyl CF<sub>3</sub>Me 2- Naphthyl CF<sub>3</sub>Me 1- Me-Pyrazol-5-yl CF<sub>3</sub>Me 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl CF<sub>3</sub>Me 2- F-Furan-3- yl CF<sub>3</sub>Me Oxazol-2- yl CF<sub>3</sub>

Me 1,2,4-Oxadiazol-3-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl CF <sub>3</sub>
Me 1,2,4-Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me 1,2,4-Triazol-1-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 4- Triazol-1- yl CF <sub>3</sub>
Me 1,2,3-Triazol-1-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 3- Triazol-1- yl CF <sub>3</sub>
Me 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl CF <sub>3</sub>
Me 6-MeO-Pyrimidin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 6-MeO-Pyrimidin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Pyridazin-3-yl CF <sub>3</sub>	Me Pyridazin-3- yl CF <sub>3</sub>
Me 1,3,5-Triazin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 3, 5-Triazin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 1,2,4-Triazin-6-yl CF <sub>3</sub>	Me 1, 2, 4- Triazin-6-yl CF <sub>3</sub>
Me 1-Me-Pyrrol-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 1- Me-Pyrrol-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Furan-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Furan-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Thiophen-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Thiophen-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Thiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me Thiazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me 3-Me-Isotiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 3- Me-Isotiazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me Isoxazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me Isoxazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me 1-Me-Imidazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 1- Me-Imidazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl CF <sub>3</sub>
Me Pyridin-4-yl CF <sub>3</sub>	Me Pyridin-4- yl CF <sub>3</sub>
Me Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Quinoxalin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 6-Cl-Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 6-Cl-Quinoxalin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 6-F-Quinoxalin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 6-F-Quinoxalin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 1-Me-Indol-3-yl CF <sub>3</sub>	Me 1- Me-Indol-3- yl CF <sub>3</sub>
Me Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Benzothiazol-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 5-F-Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 5-F-Benzothiazol-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 6-F-Benzothiazol-2-yl CF <sub>3</sub>	Me 6-F-Benzothiazol-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Quinolin-4-yl CF <sub>3</sub>	Me Quinolin-4- yl CF <sub>3</sub>
Me Pyrazin-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Pyrazin-2- yl CF <sub>3</sub>
Me 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl CF <sub>3</sub>	Me 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl CF <sub>3</sub>
Me Benzofuran-2-yl CF <sub>3</sub>	Me Benzofuran-2- yl CF <sub>3</sub>
Me Ph CF <sub>3</sub>	Me Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-Ph CF <sub>3</sub>

Me 3-F-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- F-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-Br-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- Br-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-Cl-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- Cl-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-MeO-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- MeO-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,6-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 3, 4, 5, 6-F <sub>5</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-Et-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- Et-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-i-Pr-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- i- Pr-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-t-Bu-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- t-Bu-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-i-PrO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- i- PrO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-t-BuO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- t-BuO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-CHF <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- CHF <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-CF <sub>3</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- CF <sub>3</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeS-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeS-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-CHO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- CHO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-NO <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- NO <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-CN-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- CN-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-PhCH <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- PhCH <sub>2</sub> O-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeC ( O ) -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-PhC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- PhC ( O ) -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeOCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>

Me 4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeSCH <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeC(O)O-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeC ( O ) O-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-Ph-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- Ph-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-PhO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- PhO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,3-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4-F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-6-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-6-Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-6-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-6-Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-6-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-6-MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-F-4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- F-4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-F-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- F-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-F-4-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- F-4- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-2-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-2- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-2-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-2- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-2-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-2- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-3-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-3- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-3-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-3- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-F-3-MeO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- F-3- MeO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-OH-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- OH-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-I-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- I-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-MeOC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- MeOC ( O ) -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 6-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>

Me 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- CF <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-Br-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- Br-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3-Br-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3- Br-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-MeC(O)-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- MeC (O ) -Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-c-Pr-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- c-Pr-Ph CF <sub>3</sub>
Me 4-PhS-Ph CF <sub>3</sub>	Me 4- PhS-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 3- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 5-Me <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-I-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- I-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-EtO-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- EtO-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-6-Ph-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-6-Ph-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-methylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- methylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>
Me 3,4-ethylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>	Me 3, 4- ethylenedioxy-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-F-4-Br-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- F-4- Br-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2-Cl-4-Me-Ph CF <sub>3</sub>	Me 2- Cl-4- Me-Ph CF <sub>3</sub>
Me 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>	Me 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> -Ph CF <sub>3</sub>
Et Et CF <sub>3</sub>	Et Et CF <sub>3</sub>
Et n-Pr CF <sub>3</sub>	Et n- Pr CF <sub>3</sub>
Et i-Pr CF <sub>3</sub>	Et i- Pr CF <sub>3</sub>
Et n-Bu CF <sub>3</sub>	Et n- Bu CF <sub>3</sub>
Et s-Bu CF <sub>3</sub>	Et s-Bu CF <sub>3</sub>
Et t-Bu CF <sub>3</sub>	Et t-Bu CF <sub>3</sub>
Et CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	Et CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	Et CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Et 1-Naphthyl CF <sub>3</sub>	Et 1- Naphthyl CF <sub>3</sub>
Et 2-Naphthyl CF <sub>3</sub>	Et 2- Naphthyl CF <sub>3</sub>
Et Ph CF <sub>3</sub>	Et Ph CF <sub>3</sub>
Et 2-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Et 2- Cl-Ph CF <sub>3</sub>
Et 4-Cl-Ph CF <sub>3</sub>	Et 4- Cl-Ph CF <sub>3</sub>

Et 2-F-Ph CF<sub>3</sub>Et 2- F-Ph CF<sub>3</sub>Et 4-F-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- F-Ph CF<sub>3</sub>Et 2-Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 2- Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 3-Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 3- Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 4-Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 2-MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 2- MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 3-MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 3- MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 4-MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- MeO-Ph CF<sub>3</sub>Et 4-Br-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- Br-Ph CF<sub>3</sub>

Et	2,6-F2-Ph	CF3
Et	2 and 6 -F2- Ph	CF3
Et	4-CF3-Ph	CF3
Et	4 -CF3- Ph	CF3
Et	4-Ph-Ph	CF3
Et	4 -Ph-Ph	CF3
Et	4-PhO-Ph	CF3
Et	4 -PhO-Ph	CF3
Et	2,3-F2-Ph	CF3
Et	2 and 3 -F2- Ph	CF3
Et	2,5-F2-Ph	CF3
Et	2 and 5 -F2- Ph	CF3
Et	3,4-F2-Ph	CF3
Et	3 and 4 -F2- Ph	CF3
Et	3,5-F2-Ph	CF3
Et	3 and 5 -F2- Ph	CF3
Et	2,4-F2-Ph	CF3
Et	2 and 4 -F2- Ph	CF3

Et	2-F-4-Cl-Ph	CF3
Et	2 -F-4- Cl-Ph	CF3
Et	2-F-4-Me-Ph	CF3
Et	2 -F-4- Me-Ph	CF3
Et	2-F-4-MeO-Ph	CF3
Et	2 -F-4- MeO-Ph	CF3
Et	3-F-4-Cl-Ph	CF3
Et	3 -F-4- Cl-Ph	CF3
Et	3-F-4-Me-Ph	CF3
Et	3 -F-4- Me-Ph	CF3
Et	3-F-4-MeO-Ph	CF3
Et	3 -F-4- MeO-Ph	CF3
Et	4-F-2-Cl-Ph	CF3
Et	4 -F-2- Cl-Ph	CF3
Et	4-F-2-Me-Ph	CF3
Et	4 -F-2- Me-Ph	CF3
Et	4-F-2-MeO-Ph	CF3
Et	4 -F-2- MeO-Ph	CF3
Et	4-F-3-Cl-Ph	CF3
Et	4 -F-3- Cl-Ph	CF3
Et	4-F-3-Me-Ph	CF3
Et	4 -F-3- Me-Ph	CF3
Et	4-F-3-MeO-Ph	CF3
Et	4 -F-3- MeO-Ph	CF3



Et	2,6-(MeO)2-P	CF3
Et	2 and 6 - (MeO ) 2 -P	CF3
Et	2-Br-Ph	CF3
Et	2 -Br-Ph	CF3
Et	3-Br-Ph	CF3
Et	3 -Br-Ph	CF3
Et	4-EtO-Ph	CF3
Et	4 -EtO-Ph	CF3
Et	2,3-Me2-Ph	CF3
Et	2 and 3 -Me2- Ph	CF3
Et	3,4-Me2-Ph	CF3
Et	3 and 4 -Me2- Ph	CF3
Et	3,5-Me2-Ph	CF3
Et	3 and 5 -Me2- Ph	CF3
Et	2-Cl-3-Me-Ph	CF3
Et	2 -Cl-3- Me-Ph	CF3
Et	2-Cl-4-Me-Ph	CF3
Et	2 -Cl-4- Me-Ph	CF3
Et	3-Cl-4-Me-Ph	CF3
Et	3 -Cl-4- Me-Ph	CF3

Et 4-Cl-2-Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- Cl-2- Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 4-Cl-3-Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 4- Cl-3- Me-Ph CF<sub>3</sub>Et 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph CF<sub>3</sub>Et 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph CF<sub>3</sub>Pr Et CF<sub>3</sub>Pr Et CF<sub>3</sub>Pr n-Pr CF<sub>3</sub>Pr n- Pr CF<sub>3</sub>Pr i-Pr CF<sub>3</sub>Pr i- Pr CF<sub>3</sub>

Pr s-Bu CF<sub>3</sub>Pr t-Bu CF<sub>3</sub>Pr CF<sub>3</sub> CF<sub>3</sub>Pr CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl CF<sub>3</sub>Pr Ph CF<sub>3</sub>Pr 2-Cl-Ph CF<sub>3</sub>Pr 4-Cl-Ph CF<sub>3</sub>Pr 2-F-Ph CF<sub>3</sub>Pr 4-F-Ph CF<sub>3</sub>Pr s-Bu CF<sub>3</sub>Pr t-Bu CF<sub>3</sub>Pr CF<sub>3</sub> CF<sub>3</sub>Pr CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl CF<sub>3</sub>Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl CF<sub>3</sub>Pr Ph CF<sub>3</sub>Pr 2-Cl-Ph CF<sub>3</sub>Pr 4-Cl-Ph CF<sub>3</sub>Pr 2-F-Ph CF<sub>3</sub>Pr 4-F-Ph CF<sub>3</sub>

Pr	2-Me-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2-Me-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	4-Me-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	4-Me-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	4-Br-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	4-Br-Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2 and 6 -F <sub>2</sub> - Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2,3-F <sub>2</sub> -Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2 and 3 -F <sub>2</sub> - Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2,5-F <sub>2</sub> -Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	2 and 5 -F <sub>2</sub> - Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	3,4-F <sub>2</sub> -Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	3 and 4 -F <sub>2</sub> - Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	CF <sub>3</sub>
Pr	3 and 5 -F <sub>2</sub> - Ph	CF <sub>3</sub>

Pr	2,4-F2-Ph	CF3
Pr	2 and 4 -F2- Ph	CF3
Pr	2-Br-Ph	CF3
Pr	2 -Br-Ph	CF3
Br	n-Pr	CF3
Br	n- Pr	CF3
Br	i-Pr	CF3
Br	i- Pr	CF3
Br	s-Bu	CF3
Br	s-Bu	CF3
Br	t-Bu	CF3
Br	t-Bu	CF3
Br	CF3	CF3
Br	CF3	CF3
Br	CF2CF3	CF3
Br	CF2CF3	CF3
Br	Ph	CF3
Br	Ph	CF3
Br	2-Cl-Ph	CF3
Br	2 -Cl-Ph	CF3
Br	4-Cl-Ph	CF3
Br	4 -Cl-Ph	CF3
Br	2-F-Ph	CF3
Br	2 -F-Ph	CF3

Br	4-F-Ph	CF3
Br	4 -F-Ph	CF3
Br	2-Me-Ph	CF3
Br	2 -Me-Ph	CF3
Br	4-Me-Ph	CF3
Br	4 -Me-Ph	CF3
Br	4-Br-Ph	CF3
Br	4 -Br-Ph	CF3
i-Pr	i-Pr	CF3
i- Pr	i- Pr	CF3
i-Pr	s-Bu	CF3
i- Pr	s-Bu	CF3
i-Pr	t-Bu	CF3
i- Pr	t-Bu	CF3
i-Pr	CF3	CF3
i- Pr	CF3	CF3
i-Pr	CF2CF3	CF3
i- Pr	CF2CF3	CF3
i-Pr	Ph	CF3
i- Pr	Ph	CF3
i-Pr	2-Cl-Ph	CF3
i- Pr	2 -Cl-Ph	CF3
i-Pr	4-Cl-Ph	CF3
i- Pr	4 -Cl-Ph	CF3

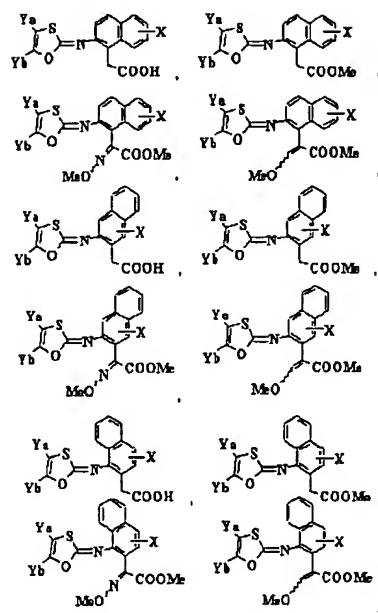
i-Pr	2-F-Ph	CF3
i-Pr	2-F-Ph	CF3
i-Pr	4-F-Ph	CF3
i-Pr	4-F-Ph	CF3
i-Pr	2-Me-Ph	CF3
i-Pr	2-Me-Ph	CF3
i-Pr	4-Me-Ph	CF3
i-Pr	4-Me-Ph	CF3
i-Pr	4-Br-Ph	CF3
i-Pr	4-Br-Ph	CF3
i-Pr	2-Br-Ph	CF3
i-Pr	2-Br-Ph	CF3
[		

【0227】

[0227]

【化 50】

[Chemical Formula 50]

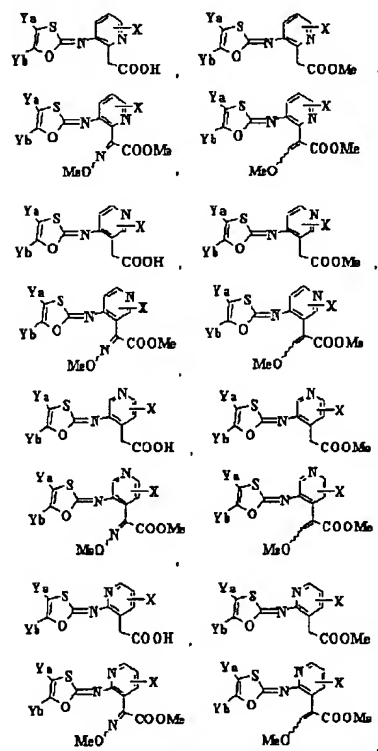


[0228]

[0228]

[化 51]

[Chemical Formula 51]

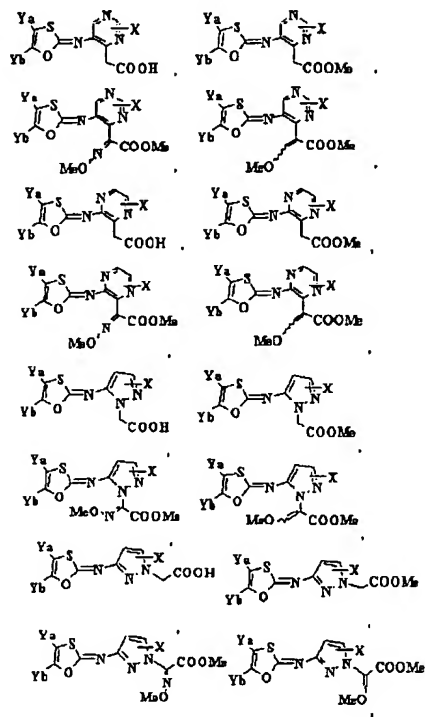


[0229]

[0229]

【化 52】

[Chemical Formula 52]

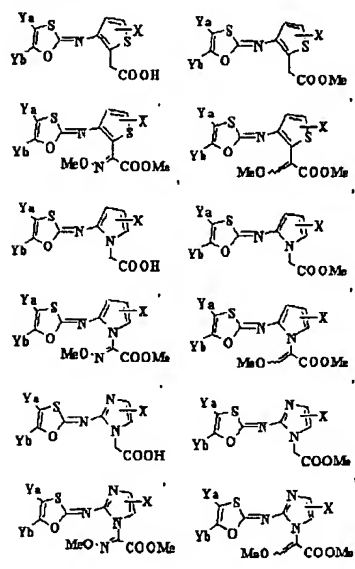


【0230】

[0230]

【化 53】

[Chemical Formula 53]

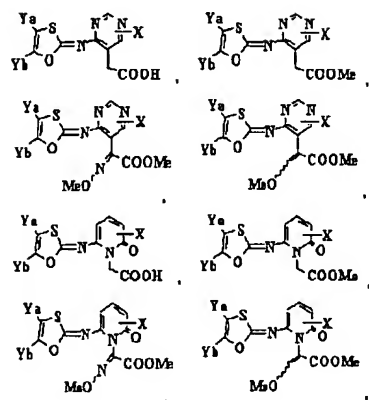


【0231】

[0231]

【化 54】

[Chemical Formula 54]

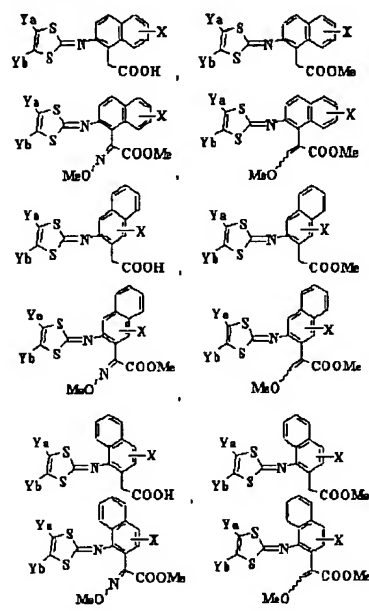


[0232]

[0232]

[化 55]

[Chemical Formula 55]



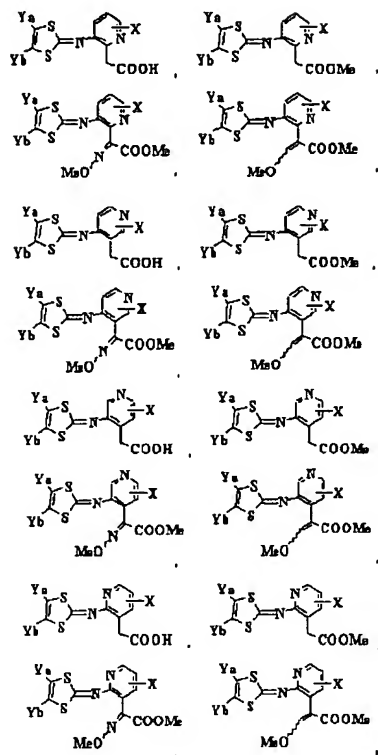
[0233]

[0233]

[化 56]

[Chemical Formula 56]



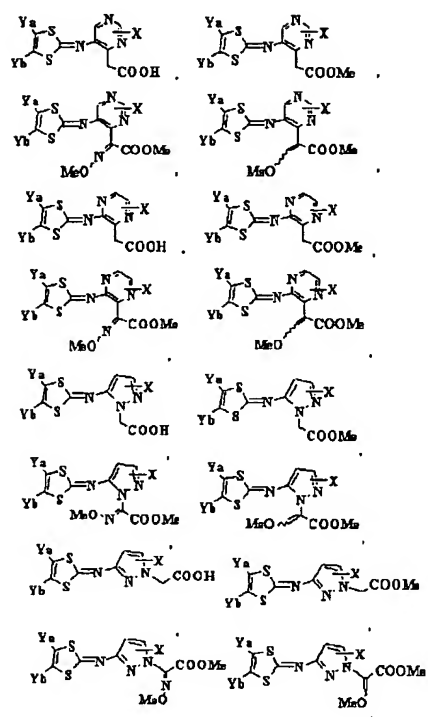


【0234】

【化 57】

[0234]

[Chemical Formula 57]

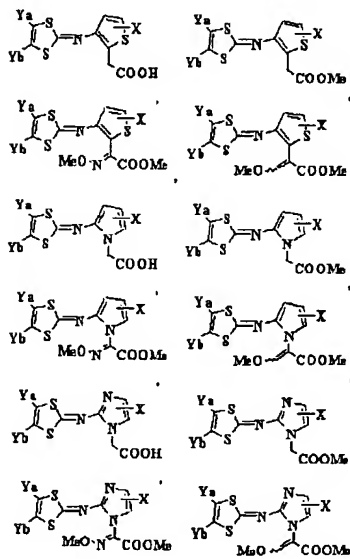


[0235]

[0235]

[化 58]

[Chemical Formula 58]

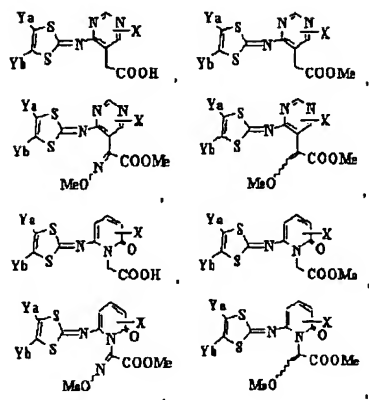


[0236]

[0236]

[化 59]

[Chemical Formula 59]

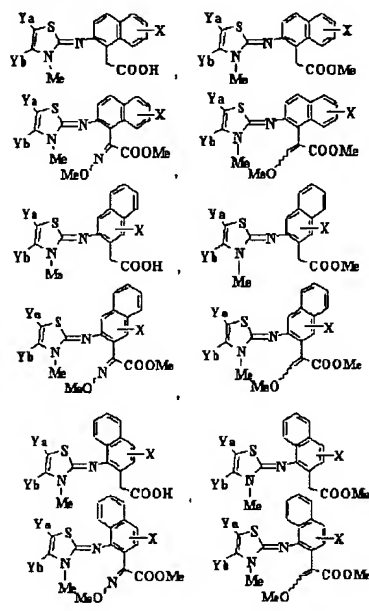


[0237]

[0237]

[化 60]

[Chemical Formula 60]

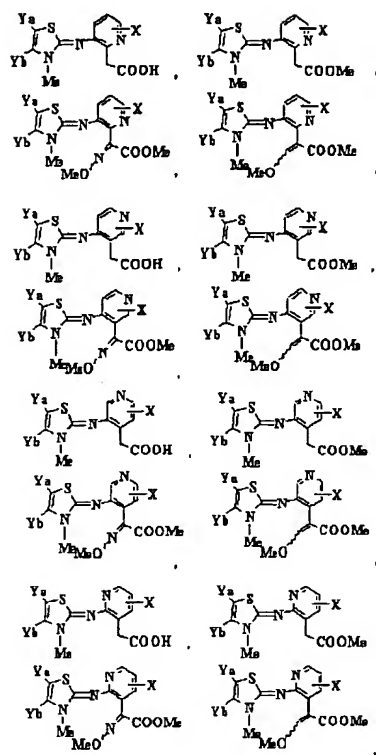


[0238]

[0238]

[化 61]

[Chemical Formula 61]

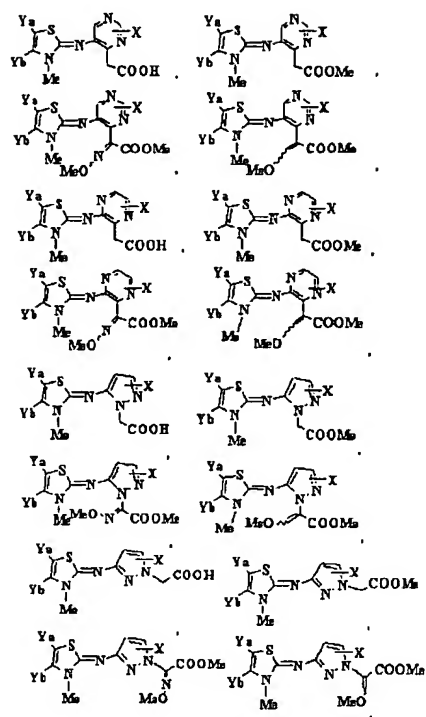


【0239】

【化 62】

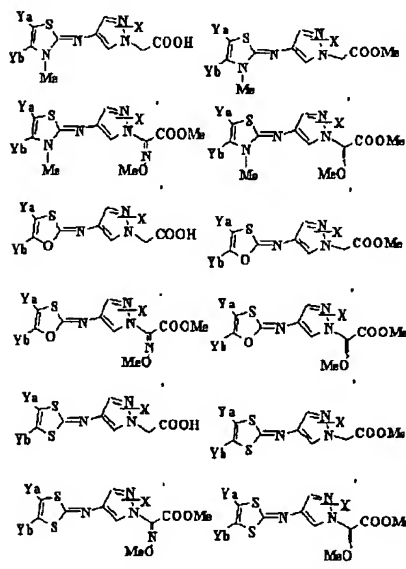
[0239]

[Chemical Formula 62]



[0240]

[化 63]



[0241]

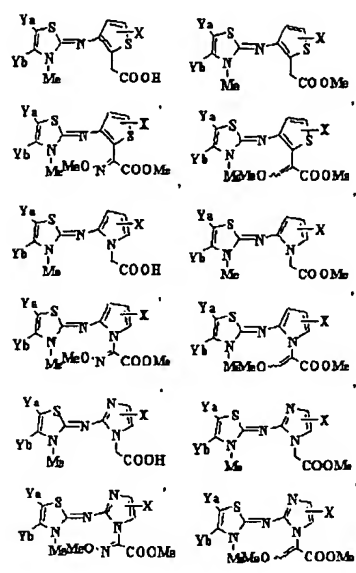
[化 64]

[0240]

[Chemical Formula 63]

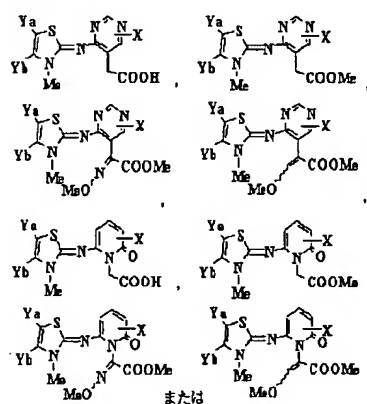
[0241]

[Chemical Formula 64]



【0242】

【化 65】



【0243】

【表 2】

Y<sub>a</sub> Y<sub>b</sub> X

H H H

H Cl H

H F H

[0242]

[Chemical Formula 65]

[0243]

[Table 2]

Y<sub>a</sub> Y<sub>b</sub> X

H H H

HCl H

HF H

H Br H	H Br H
H I H	H I H
H Me H	H Me H
H Et H	H Et H
H n-Pr H	H n- Pr H
H i-Pr H	H i- Pr H
H n-Bu H	H n- Bu H
H i-Bu H	H i- Bu H
H s-Bu H	H s-Bu H
H t-Bu H	H t-Bu H
H n-Pen H	H n- Pen H
H 3-Me-n-Bu H	H 3- Me-n- Bu H
H n-Hex H	H n- Hex H
H Ethenyl H	H Ethenyl H
H 1-Propenyl H	H 1- Propenyl H
H Ethynyl H	H Ethynyl H
H CF <sub>3</sub> H	HC F<sub>3</sub> H
H c-Pr H	H c-Pr H
H c-Hex H	H c-Hex H
H MeO H	H MeO H
H t-BuO H	H t-BuO H
H CF <sub>3</sub> O H	HC F<sub>3</sub>O H
H MeS H	H MeS H
H MeSO H	H MeSO H
H MeSO <sub>2</sub> H	H MeSO<sub>2</sub> H
H NO <sub>2</sub> H	H NO<sub>2</sub> H
H NC H	H NC H
H CHO H	HC HO H
H Me <sub>2</sub> N H	H Me<sub>2</sub>N H
H PhCH <sub>2</sub> H	H PhCH<sub>2</sub> H
H PhCH=CH H	H PhCH=CH H
H 4-Cl-PHCH=CH H	H 4- Cl-PHCH=CH H
H PhCH=CHCH <sub>2</sub> H	H PhCH=CHCH<sub>2</sub> H
H PhCC H	H PhCC H
H Ph H	H Ph H

H MeNHC(O) H	H MeNHC (O ) H
H PhNHC(O) H	H PhNHC (O ) H
H EtNHC(O) H	H EtNHC (O ) H
H 2-F-PhNHC(O) H	H 2- F-PhNHC (O ) H
H 3-F-PhNHC(O) H	H 3- F-PhNHC (O ) H
H 4-F-PhNHC(O) H	H 4- F-PhNHC (O ) H
H 2-Cl-PhNHC(O) H	H 2- Cl-PhNHC (O ) H
H 3-Cl-PhNHC(O) H	H 3- Cl-PhNHC (O ) H
H 4-Cl-PhNHC(O) H	H 4- Cl-PhNHC (O ) H
H 2-Me-PhNHC(O) H	H 2- Me-PhNHC (O ) H
H 3-Me-PhNHC(O) H	H 3- Me-PhNHC (O ) H
H 4-Me-PhNHC(O) H	H 4- Me-PhNHC (O ) H
H 2-Br-PhNHC(O) H	H 2- Br-PhNHC (O ) H
H 3-Br-PhNHC(O) H	H 3- Br-PhNHC (O ) H
H 4-Br-PhNHC(O) H	H 4- Br-PhNHC (O ) H
H 2-MeO-PhNHC(O) H	H 2- MeO-PhNHC (O ) H
H 3-MeO-PhNHC(O) H	H 3- MeO-PhNHC (O ) H
H 4-MeO-PhNHC(O) H	H 4- MeO-PhNHC (O ) H
H 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) H	H 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) H
H MeOC(O) H	H MeOC (O ) H
H MeOCH <sub>2</sub> H	H MeOCH <sub>2</sub> H
H MeOC(=NOMe) H	H MeOC (=NOMe ) H
H MeC(=NOMe) H	H MeC (=NOMe ) H
H MeC(O) H	H MeC (O ) H
H CH <sub>2</sub> SMe H	HC H <sub>2</sub> SMe H
H CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H	HC H <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H
H Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> H	H Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> H
H ClCH <sub>2</sub> H	HCl CH <sub>2</sub> H
H BrCH <sub>2</sub> H	H BrCH <sub>2</sub> H
H CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H	HC F <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H
H PhC(O)NH H	H PhC (O ) NH H
H 1-Naphthyl H	H 1- Naphthyl H
H 2-Naphthyl H	H 2- Naphthyl H
H 1-Me-Pyrazol-5-yl H	H 1- Me-Pyrazol-5-yl H
H 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl H	H 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl H



H 2-F-Furan-3-yl H	H 2- F-Furan-3- yl H
H Oxazol-2-yl H	H Oxazol-2- yl H
H 1,2,4-Oxadiazol-3-yl H	H 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl H
H 1,2,4-Thiadiazol-5-yl H	H 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl H
H 1,2,4-Triazol-1-yl H	H 1, 2, 4- Triazol-1- yl H
H 1,2,3-Triazol-1-yl H	H 1, 2, 3- Triazol-1- yl H
H 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl H	H 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl H
H 6-MeO-Pyrimidin-2-yl H	H 6-MeO-Pyrimidin-2- yl H
H Pyridazin-3-yl H	H Pyridazin-3- yl H
H 1,3,5-Triazin-2-yl H	H 1, 3, 5-Triazin-2- yl H
H 1,2,4-Triazin-6-yl H	H 1, 2, 4- Triazin-6-yl H
H 1-Me-Pyrrol-2-yl H	H 1- Me-Pyrrol-2- yl H
H Furan-2-yl H	HF uran- 2- yl H
H Thiophen-2-yl H	H Thiophen-2- yl H
H Thiazol-5-yl H	H Thiazol-5-yl H
H 2,4-Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H	H 2, 4- Me <sub>2</sub> -Oxazol-5-yl H
H 3-Me-Isothiazol-5-yl H	H 3- Me-Isothiazol-5-yl H
H Isoxazol-5-yl H	H Isoxazol-5-yl H
H 1-Me-Imidazol-5-yl H	H 1- Me-Imidazol-5-yl H
H 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl H	H 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl H
H Pyridin-4-yl H	H Pyridin-4- yl H
H Quinoxalin-2-yl H	H Quinoxalin-2- yl H
H 6-Cl-Quinoxalin-2-yl H	H 6-Cl-Quinoxalin-2- yl H
H 6-F-Quinoxalin-2-yl H	H 6-F-Quinoxalin-2- yl H
H 1-Me-Indol-3-yl H	H 1- Me-Indol-3- yl H
H Benzothiazol-2-yl H	H Benzothiazol-2- yl H
H 5-F-Benzothiazol-2-yl H	H 5-F-Benzothiazol-2- yl H
H 6-F-Benzothiazol-2-yl H	H 6-F-Benzothiazol-2- yl H
H Quinolin-4-yl H	H Quinolin-4- yl H
H Pyrazin-2-yl H	H Pyrazin-2- yl H
H 4-CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H	H 4- CClF <sub>2</sub> -Pyrimidin-5-yl H
H Benzofuran-2-yl H	H Benzofuran-2- yl H
H Ph H	H Ph H
H 2-Cl-Ph H	H 2- Cl-Ph H
H 3-Cl-Ph H	H 3- Cl-Ph H

H 4-Cl-Ph H  
H 2-F-Ph H  
H 3-F-Ph H  
H 4-F-Ph H  
H 2-Me-Ph H  
H 3-Me-Ph H  
H 4-Me-Ph H  
H 2-MeO-Ph H  
H 3-MeO-Ph H  
H 4-MeO-Ph H  
H 4-Br-Ph H  
H 2,4-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
H 3,4-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
H 2,4,6-Cl<sub>3</sub>-Ph H  
H 3,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H  
H 2-Cl-4-Me-Ph H  
H 2-MeO-4-Me-Ph H  
H 2,4-Me<sub>2</sub>-Ph H  
H 2,5-Me<sub>2</sub>-Ph H  
H 2,6-F<sub>2</sub>-Ph H  
H 2,3,4,5,6-F<sub>5</sub>-Ph H  
H 4-Et-Ph H  
H 4-i-Pr-Ph H  
H 4-t-Bu-Ph H  
H 4-CF<sub>3</sub>-Ph H  
H 4-i-PrO-Ph H  
H 4-t-BuO-Ph H  
H 4-CHF<sub>2</sub>O-Ph H  
H 4-CF<sub>3</sub>O-Ph H  
H 4-MeS-Ph H  
H 4-CHO-Ph H  
H 4-NO<sub>2</sub>-Ph H  
H 4-CN-Ph H  
H 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph H  
H 4-MeC(O)-Ph H

H 4- Cl-Ph H  
H 2- F-Ph H  
H 3- F-Ph H  
H 4- F-Ph H  
H 2- Me-Ph H  
H 3- Me-Ph H  
H 4- Me-Ph H  
H 2- MeO-Ph H  
H 3- MeO-Ph H  
H 4- MeO-Ph H  
H 4- Br-Ph H  
H 2, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
H 3, 4- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
H 2, 4, 6-Cl<sub>3</sub>-Ph H  
H 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H  
H 2- Cl-4- Me-Ph H  
H 2- MeO-4- Me-Ph H  
H 2, 4- Me<sub>2</sub>-Ph H  
H 2, 5-Me<sub>2</sub>-Ph H  
H 2, 6-F<sub>2</sub>-Ph H  
H 2, 3, 4, 5, 6-F<sub>5</sub>-Ph H  
H 4- Et-Ph H  
H 4- i- Pr-Ph H  
H 4- t-Bu-Ph H  
H 4- CF<sub>3</sub>-Ph H  
H 4- i- PrO-Ph H  
H 4- t-BuO-Ph H  
H 4- CHF <sub>2</sub>-O-Ph H  
H 4- CF<sub>3</sub>-O-Ph H  
H 4- MeS-Ph H  
H 4- CHO-Ph H  
H 4- NO<sub>2</sub>-Ph H  
H 4- CN-Ph H  
H 4- PhCH<sub>2</sub>-O-Ph H  
H 4- MeC (O ) -Ph H

H 4-PhC(O)-Ph H	H 4- PhC (O ) -Ph H
H 4-MeOCH <sub>2</sub> -Ph H	H 4- MeOCH <sub>2</sub> -Ph H
H 4-MeSCH <sub>2</sub> -Ph H	H 4- MeSCH <sub>2</sub> -Ph H
H 4-MeC(O)O-Ph H	H 4- MeC (O ) O-Ph H
H 4-Ph-Ph H	H 4- Ph-Ph H
H 4-PhO-Ph H	H 4- PhO-Ph H
H 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 3- Cl <sub>2</sub> -Ph H
H 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph H
H 2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 6-Cl <sub>2</sub> -Ph H
H 2,5-Cl <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 5-Cl <sub>2</sub> -Ph H
H 2,3-F <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph H
H 2,5-F <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
H 3,4-F <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
H 3,5-F <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
H 2,4-F <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
H 2-CF <sub>3</sub> -Ph H	H 2- CF <sub>3</sub> -Ph H
H 2-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph H	H 2- F-6-CF <sub>3</sub> -Ph H
H 2-F-6-Cl-Ph H	H 2- F-6-Cl-Ph H
H 2-F-6-Me-Ph H	H 2- F-6-Me-Ph H
H 2-F-6-MeO-Ph H	H 2- F-6-MeO-Ph H
H 2-F-4-Cl-Ph H	H 2- F-4- Cl-Ph H
H 2-F-4-CF <sub>3</sub> -Ph H	H 2- F-4- CF <sub>3</sub> -Ph H
H 2-F-4-Me-Ph H	H 2- F-4- Me-Ph H
H 2-F-4-MeO-Ph H	H 2- F-4- MeO-Ph H
H 3-F-4-Cl-Ph H	H 3- F-4- Cl-Ph H
H 3-F-4-Me-Ph H	H 3- F-4- Me-Ph H
H 3-F-4-MeO-Ph H	H 3- F-4- MeO-Ph H
H 4-F-2-Cl-Ph H	H 4- F-2- Cl-Ph H
H 4-F-2-Me-Ph H	H 4- F-2- Me-Ph H
H 4-F-2-MeO-Ph H	H 4- F-2- MeO-Ph H
H 4-F-3-Cl-Ph H	H 4- F-3- Cl-Ph H
H 4-F-3-Me-Ph H	H 4- F-3- Me-Ph H
H 4-F-3-MeO-Ph H	H 4- F-3- MeO-Ph H
H 2-OH-Ph H	H 2- OH-Ph H
H 4-I-Ph H	H 4- I-Ph H

H 4-MeOC(O)-Ph H	H 4- MeOC (O ) -Ph H
H 2,6-Me <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 6-Me<sub>2</sub>-Ph H
H 2,6-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
H 3-CF <sub>3</sub> -Ph H	H 3- CF<sub>3</sub>-Ph H
H 2-Br-Ph H	H 2- Br-Ph H
H 3-Br-Ph H	H 3- Br-Ph H
H 2-MeC(O)-Ph H	H 2- MeC (O ) -Ph H
H 4-c-Pr-Ph H	H 4- c-Pr-Ph H
H 4-PhS-Ph H	H 4- PhS-Ph H
H 2,3-Me <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph H
H 3,4-Me <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 4- Me<sub>2</sub>-Ph H
H 3,5-Me <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 5-Me<sub>2</sub>-Ph H
H 2,3-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
H 2,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
H 2,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	H 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
H 3,5-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	H 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H
H 2-F-4-I-Ph H	H 2- F-4- I-Ph H
H 2-F-4-EtO-Ph H	H 2- F-4- EtO-Ph H
H 2-F-6-Ph-Ph H	H 2- F-6-Ph-Ph H
H 3,4-methylenedioxy-Ph H	H 3, 4- methylenedioxy-Ph H
H 3,4-ethylenedioxy-Ph H	H 3, 4- ethylenedioxy-Ph H
H 2-F-4-Br-Ph H	H 2- F-4- Br-Ph H
H 2-Cl-4-Me-Ph H	H 2- Cl-4- Me-Ph H
H 2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph H	H 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph H
-CH=CH-CH=CH- H	-CH=CH-CH=CH- H
-CH=N-CH=CH- H	-CH=N- CH=CH- H
-N=CH-CH=CH- H	-N=CH-CH=CH- H
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - H	- (CH<sub>2</sub> ) <sub>3</sub>- H
-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - H	- (CH<sub>2</sub> ) <sub>4</sub>- H
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - H	-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>- H
-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - H	-CO- (CH<sub>2</sub> ) <sub>3</sub>- H
-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> Ph)-CH <sub>2</sub> - H	-CH<sub>2</sub>-CH (CH<sub>2</sub>Ph ) -CH<sub>2</sub>- H
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(Me)-CH <sub>2</sub> - H	-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH (Me ) -CH<sub>2</sub>- H
-CH=CH-CH=C(OMe)- H	-CH=CH-CH=C (OMe ) -H

Me H H	Me H H
Me Cl H	Me Cl H
Me F H	Me F H
Me Br H	Me Br H
Me I H	Me I H
Me Me H	Me Me H
Me Et H	Me Et H
Me n-Pr H	Me n- Pr H
Me i-Pr H	Me i- Pr H
Me n-Bu H	Me n- Bu H
Me i-Bu H	Me i- Bu H
Me s-Bu H	Me s-Bu H
Me t-Bu H	Me t-Bu H
Me n-Pen H	Me n- Pen H
Me 3-Me-n-Bu H	Me 3- Me-n- Bu H
Me n-Hex H	Me n- Hex H
Me Ethenyl H	Me Ethenyl H
Me 1-Propenyl H	Me 1- Propenyl H
Me Ethynyl H	Me Ethynyl H
Me CF <sub>3</sub> H	Me CF <sub>3</sub> H
Me c-Pr H	Me c-Pr H
Me c-Hex H	Me c-Hex H
Me MeO H	Me MeO H
Me t-BuO H	Me t-BuO H
Me CF <sub>3</sub> O H	Me CF <sub>3</sub> O H
Me MeS H	Me MeS H
Me MeSO H	Me MeSO H
Me MeSO <sub>2</sub> H	Me MeSO <sub>2</sub> H
Me NO <sub>2</sub> H	Me NO <sub>2</sub> H
Me NC H	Me NC H
Me CHO H	Me CHO H
Me Me <sub>2</sub> N H	Me Me <sub>2</sub> N H
Me PhCH <sub>2</sub> H	Me PhCH <sub>2</sub> H
Me PhCH=CH H	Me PhCH=CH H
Me 4-Cl-PHCH=CH H	Me 4- Cl-PHCH=CH H

Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> H	Me PhCH=CHCH <sub>2</sub> H
Me PhCC H	Me PhCC H
Me Ph H	Me Ph H
Me MeNHC(O) H	Me MeNHC (O ) H
Me PhNHC(O) H	Me PhNHC (O ) H
Me EtNHC(O) H	Me EtNHC (O ) H
Me 2-F-PhNHC(O) H	Me 2- F-PhNHC (O ) H
Me 3-F-PhNHC(O) H	Me 3- F-PhNHC (O ) H
Me 4-F-PhNHC(O) H	Me 4- F-PhNHC (O ) H
Me 2-Cl-PhNHC(O) H	Me 2- Cl-PhNHC (O ) H
Me 3-Cl-PhNHC(O) H	Me 3- Cl-PhNHC (O ) H
Me 4-Cl-PhNHC(O) H	Me 4- Cl-PhNHC (O ) H
Me 2-Me-PhNHC(O) H	Me 2- Me-PhNHC (O ) H
Me 3-Me-PhNHC(O) H	Me 3- Me-PhNHC (O ) H
Me 4-Me-PhNHC(O) H	Me 4- Me-PhNHC (O ) H
Me 2-Br-PhNHC(O) H	Me 2- Br-PhNHC (O ) H
Me 3-Br-PhNHC(O) H	Me 3- Br-PhNHC (O ) H
Me 4-Br-PhNHC(O) H	Me 4- Br-PhNHC (O ) H
Me 2-MeO-PhNHC(O) H	Me 2- MeO-PhNHC (O ) H
Me 3-MeO-PhNHC(O) H	Me 3- MeO-PhNHC (O ) H
Me 4-MeO-PhNHC(O) H	Me 4- MeO-PhNHC (O ) H
Me 2,6-F <sub>2</sub> -PhNHC(O) H	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -PhNHC (O ) H
Me MeOC(O) H	Me MeOC (O ) H
Me MeOCH <sub>2</sub> H	Me MeOCH <sub>2</sub> H
Me MeOC(=NOMe) H	Me MeOC (=NOMe ) H
Me MeC(=NOMe) H	Me MeC (=NOMe ) H
Me MeC(O) H	Me MeC (O ) H
Me CH <sub>2</sub> SMe H	Me CH <sub>2</sub> SMe H
Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H	Me CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph H
Me Pyrazol-1-ylCH <sub>2</sub> H	Me Pyrazol-1- ylCH <sub>2</sub> H
Me ClCH <sub>2</sub> H	Me ClCH <sub>2</sub> H
Me BrCH <sub>2</sub> H	Me BrCH <sub>2</sub> H
Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H	Me CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> H
Me PhC(O)NH H	Me PhC (O ) NH H
Me 1-Naphthyl H	Me 1- Naphthyl H

Me 2-Naphthyl H  
Me 1-Me-Pyrazol-5-yl H  
Me 1-Me-3-Cl-Pyrazol-5-yl H  
Me 2-F-Furan-3-yl H  
Me Oxazol-2-yl H  
Me 1,2,4-Oxadiazol-3-yl H  
Me 1,2,4-Thiadiazol-5-yl H  
Me 1,2,4-Triazol-1-yl H  
Me 1,2,3-Triazol-1-yl H  
Me 1,2,3,4-Tetrazol-1-yl H  
Me 6-MeO-Pyrimidin-2-yl H  
Me Pyridazin-3-yl H  
Me 1,3,5-Triazin-2-yl H  
Me 1,2,4-Triazin-6-yl H  
Me 1-Me-Pyrrol-2-yl H  
Me Furan-2-yl H  
Me Thiophen-2-yl H  
Me Thiazol-5-yl H  
Me 2,4-Me<sub>2</sub>-Oxazol-5-yl H  
Me 3-Me-Isotiazol-5-yl H  
Me Isoxazol-5-yl H  
Me 1-Me-Imidazol-5-yl H  
Me 4-Me-1,2,3-Thiadiazol-5-yl H  
Me Pyridin-4-yl H  
Me Quinoxalin-2-yl H  
Me 6-Cl-Quinoxalin-2-yl H  
Me 6-F-Quinoxalin-2-yl H  
Me 1-Me-Indol-3-yl H  
Me Benzothiazol-2-yl H  
Me 5-F-Benzothiazol-2-yl H  
Me 6-F-Benzothiazol-2-yl H  
Me Quinolin-4-yl H  
Me Pyrazin-2-yl H  
Me 4-CClF<sub>2</sub>-Pyrimidin-5-yl H  
Me Benzofuran-2-yl H

Me 2- Naphthyl H  
Me 1- Me-Pyrazol-5-yl H  
Me 1- Me-3- Cl-Pyrazol-5-yl H  
Me 2- F-Furan-3- yl H  
Me Oxazol-2- yl H  
Me 1, 2, 4- Oxadiazol-3- yl H  
Me 1, 2, 4- Thiadiazol-5-yl H  
Me 1, 2, 4- Triazol-1- yl H  
Me 1, 2, 3- Triazol-1- yl H  
Me 1, 2, 3, 4- Tetrazol-1- yl H  
Me 6-MeO-Pyrimidin-2- yl H  
Me Pyridazin-3- yl H  
Me 1, 3, 5-Triazin-2- yl H  
Me 1, 2, 4- Triazin-6-yl H  
Me 1- Me-Pyrrol-2- yl H  
Me Furan-2- yl H  
Me Thiophen-2- yl H  
Me Thiazol-5-yl H  
Me 2, 4- Me<sub>2</sub>-Oxazol-5-yl H  
Me 3- Me-Isotiazol-5-yl H  
Me Isoxazol-5-yl H  
Me 1- Me-Imidazol-5-yl H  
Me 4- Me-1, 2, 3- Thiadiazol-5-yl H  
Me Pyridin-4- yl H  
Me Quinoxalin-2- yl H  
Me 6-Cl-Quinoxalin-2- yl H  
Me 6-F-Quinoxalin-2- yl H  
Me 1- Me-Indol-3- yl H  
Me Benzothiazol-2- yl H  
Me 5-F-Benzothiazol-2- yl H  
Me 6-F-Benzothiazol-2- yl H  
Me Quinolin-4- yl H  
Me Pyrazin-2- yl H  
Me 4- CClF<sub>2</sub>-Pyrimidin-5-yl H  
Me Benzofuran-2- yl H

Me Ph H	Me Ph H
Me 2-Cl-Ph H	Me 2- Cl-Ph H
Me 3-Cl-Ph H	Me 3- Cl-Ph H
Me 4-Cl-Ph H	Me 4- Cl-Ph H
Me 2-F-Ph H	Me 2- F-Ph H
Me 3-F-Ph H	Me 3- F-Ph H
Me 4-F-Ph H	Me 4- F-Ph H
Me 2-Me-Ph H	Me 2- Me-Ph H
Me 3-Me-Ph H	Me 3- Me-Ph H
Me 4-Me-Ph H	Me 4- Me-Ph H
Me 2-MeO-Ph H	Me 2- MeO-Ph H
Me 3-MeO-Ph H	Me 3- MeO-Ph H
Me 4-MeO-Ph H	Me 4- MeO-Ph H
Me 4-Br-Ph H	Me 4- Br-Ph H
Me 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph H
Me 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 4- Cl <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph H	Me 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> -Ph H
Me 3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph H	Me 3, 4- (MeO ) <sub>2</sub> -Ph H
Me 2-Cl-4-Me-Ph H	Me 2- Cl-4- Me-Ph H
Me 2-MeO-4-Me-Ph H	Me 2- MeO-4- Me-Ph H
Me 2,4-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 4- Me <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,5-Me <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 5-Me <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,6-F <sub>2</sub> -Ph H	Me 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph H
Me 2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph H	Me 2, 3, 4, 5, 6-F <sub>5</sub> -Ph H
Me 4-Et-Ph H	Me 4- Et-Ph H
Me 4-i-Pr-Ph H	Me 4- i- Pr-Ph H
Me 4-t-Bu-Ph H	Me 4- t-Bu-Ph H
Me 4-CF <sub>3</sub> -Ph H	Me 4- CF <sub>3</sub> -Ph H
Me 4-i-PrO-Ph H	Me 4- i- PrO-Ph H
Me 4-t-BuO-Ph H	Me 4- t-BuO-Ph H
Me 4-CHF <sub>2</sub> O-Ph H	Me 4- CHF <sub>2</sub> O-Ph H
Me 4-CF <sub>3</sub> O-Ph H	Me 4- CF <sub>3</sub> O-Ph H
Me 4-MeS-Ph H	Me 4- MeS-Ph H
Me 4-CHO-Ph H	Me 4- CHO-Ph H
Me 4-NO <sub>2</sub> -Ph H	Me 4- NO <sub>2</sub> -Ph H



Me 4-CN-Ph H  
Me 4-PhCH<sub>2</sub>O-Ph H  
Me 4-MeC(O)-Ph H  
Me 4-PhC(O)-Ph H  
Me 4-MeOCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4-MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4-MeC(O)O-Ph H  
Me 4-Ph-Ph H  
Me 4-PhO-Ph H  
Me 2,3-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,6-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,3-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,4-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3,5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2,4-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-6-Cl-Ph H  
Me 2-F-6-Me-Ph H  
Me 2-F-6-MeO-Ph H  
Me 2-F-4-Cl-Ph H  
Me 2-F-4-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2-F-4-Me-Ph H  
Me 2-F-4-MeO-Ph H  
Me 3-F-4-Cl-Ph H  
Me 3-F-4-Me-Ph H  
Me 3-F-4-MeO-Ph H  
Me 4-F-2-Cl-Ph H  
Me 4-F-2-Me-Ph H  
Me 4-F-2-MeO-Ph H  
Me 4-F-3-Cl-Ph H  
Me 4-F-3-Me-Ph H

Me 4- CN-Ph H  
Me 4- PhCH<sub>2</sub>O-Ph H  
Me 4- MeC ( O ) -Ph H  
Me 4- PhC ( O ) -Ph H  
Me 4- MeOCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4- MeSCH<sub>2</sub>-Ph H  
Me 4- MeC ( O ) O-Ph H  
Me 4- Ph-Ph H  
Me 4- PhO-Ph H  
Me 2, 3- Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 6-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 5-Cl<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 3- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 4- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph H  
Me 2- CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-6-CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-6-Cl-Ph H  
Me 2- F-6-Me-Ph H  
Me 2- F-6-MeO-Ph H  
Me 2- F-4- Cl-Ph H  
Me 2- F-4- CF<sub>3</sub>-Ph H  
Me 2- F-4- Me-Ph H  
Me 2- F-4- MeO-Ph H  
Me 3- F-4- Cl-Ph H  
Me 3- F-4- Me-Ph H  
Me 3- F-4- MeO-Ph H  
Me 4- F-2- Cl-Ph H  
Me 4- F-2- Me-Ph H  
Me 4- F-2- MeO-Ph H  
Me 4- F-3- Cl-Ph H  
Me 4- F-3- Me-Ph H

Me 4-F-3-MeO-Ph H

Me 2-OH-Ph H

Me 4-I-Ph H

Me 4-MeOC(O)-Ph H

Me 2,6-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 2,6-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Me 3-CF<sub>3</sub>-Ph H

Me 2-Br-Ph H

Me 3-Br-Ph H

Me 2-MeC(O)-Ph H

Me 4-c-Pr-Ph H

Me 4-PhS-Ph H

Me 2,3-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 3,4-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 3,5-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 2,3-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Me 2,4-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Me 2,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Me 3,5-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Me 2-F-4-I-Ph H

Me 2-F-4-EtO-Ph H

Me 2-F-6-Ph-Ph H

Me 3,4-methylenedioxy-Ph H

Me 3,4-ethylenedioxy-Ph H

Me 2-F-4-Br-Ph H

Me 2-Cl-4-Me-Ph H

Me 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph H

Et Et H

Et n-Pr H

Et i-Pr H

Et n-Bu H

Et s-Bu H

Et t-Bu H

Et CF<sub>3</sub> H

Et CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H

Me 4- F-3- MeO-Ph H

Me 2- OH-Ph H

Me 4- I-Ph H

Me 4- MeOC (O ) -Ph H

Me 2, 6-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 2, 6- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

Me 3- CF<sub>3</sub>-Ph H

Me 2- Br-Ph H

Me 3- Br-Ph H

Me 2- MeC (O ) -Ph H

Me 4- c-Pr-Ph H

Me 4- PhS-Ph H

Me 2, 3- Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 3, 4- Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 3, 5-Me<sub>2</sub>-Ph H

Me 2, 3- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

Me 2, 4- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

Me 2, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

Me 3, 5- (MeO ) <sub>2</sub>-Ph H

Me 2- F-4- I-Ph H

Me 2- F-4- EtO-Ph H

Me 2- F-6-Ph-Ph H

Me 3, 4- methylenedioxy-Ph H

Me 3, 4- ethylenedioxy-Ph H

Me 2- F-4- Br-Ph H

Me 2- Cl-4- Me-Ph H

Me 2, 4, 6-Me<sub>3</sub>-Ph H

Et Et H

Et n- Pr H

Et i- Pr H

Et n- Bu H

Et s-Bu H

Et t-Bu H

Et CF<sub>3</sub> H

Et CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H

Et 1-Naphthyl H	Et 1- Naphthyl H
Et 2-Naphthyl H	Et 2- Naphthyl H
Et Ph H	Et Ph H
Et 2-Cl-Ph H	Et 2- Cl-Ph H
Et 4-Cl-Ph H	Et 4- Cl-Ph H
Et 2-F-Ph H	Et 2- F-Ph H
Et 4-F-Ph H	Et 4- F-Ph H
Et 2-Me-Ph H	Et 2- Me-Ph H
Et 3-Me-Ph H	Et 3- Me-Ph H
Et 4-Me-Ph H	Et 4- Me-Ph H
Et 2-MeO-Ph H	Et 2- MeO-Ph H
Et 3-MeO-Ph H	Et 3- MeO-Ph H
Et 4-MeO-Ph H	Et 4- MeO-Ph H
Et 4-Br-Ph H	Et 4- Br-Ph H
Et 2,6-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 6-F <sub>2</sub> -Ph H
Et 4-CF <sub>3</sub> -Ph H	Et 4- CF <sub>3</sub> -Ph H
Et 4-Ph-Ph H	Et 4- Ph-Ph H
Et 4-PhO-Ph H	Et 4- PhO-Ph H
Et 2,3-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 3- F <sub>2</sub> -Ph H
Et 2,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
Et 3,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
Et 3,5-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 3, 5-F <sub>2</sub> -Ph H
Et 2,4-F <sub>2</sub> -Ph H	Et 2, 4- F <sub>2</sub> -Ph H
Et 2-F-4-Cl-Ph H	Et 2- F-4- Cl-Ph H
Et 2-F-4-Me-Ph H	Et 2- F-4- Me-Ph H
Et 2-F-4-MeO-Ph H	Et 2- F-4- MeO-Ph H
Et 3-F-4-Cl-Ph H	Et 3- F-4- Cl-Ph H
Et 3-F-4-Me-Ph H	Et 3- F-4- Me-Ph H
Et 3-F-4-MeO-Ph H	Et 3- F-4- MeO-Ph H
Et 4-F-2-Cl-Ph H	Et 4- F-2- Cl-Ph H
Et 4-F-2-Me-Ph H	Et 4- F-2- Me-Ph H
Et 4-F-2-MeO-Ph H	Et 4- F-2- MeO-Ph H
Et 4-F-3-Cl-Ph H	Et 4- F-3- Cl-Ph H
Et 4-F-3-Me-Ph H	Et 4- F-3- Me-Ph H
Et 4-F-3-MeO-Ph H	Et 4- F-3- MeO-Ph H

Et 2,6-(MeO)<sub>2</sub>-Ph H

Et 2-Br-Ph H

Et 3-Br-Ph H

Et 4-EtO-Ph H

Et 2,3-Me<sub>2</sub>-Ph HEt 3,4-Me<sub>2</sub>-Ph HEt 3,5-Me<sub>2</sub>-Ph H

Et 2-Cl-3-Me-Ph H

Et 2-Cl-4-Me-Ph H

Et 3-Cl-4-Me-Ph H

Et 4-Cl-2-Me-Ph H

Et 4-Cl-3-Me-Ph H

Et 2,4,6-Me<sub>3</sub>-Ph H

Pr Et H

Pr n-Pr H

Pr i-Pr H

Pr s-Bu H

Pr t-Bu H

Pr CF<sub>3</sub> HPr CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H

Pr 1-Me-3-Cl-Pyrazol-4-yl H

Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-3-yl H

Pr 1-Me-5-Cl-Pyrazol-4-yl H

Pr Ph H

Pr 2-Cl-Ph H

Pr 4-Cl-Ph H

Pr 2-F-Ph H

Pr 4-F-Ph H

Pr 2-Me-Ph H

Pr 4-Me-Ph H

Pr 4-Br-Ph H

Pr 2,6-F<sub>2</sub>-Ph HPr 2,3-F<sub>2</sub>-Ph HPr 2,5-F<sub>2</sub>-Ph HPr 3,4-F<sub>2</sub>-Ph H

Et 2, 6- (MeO ) &lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Et 2- Br-Ph H

Et 3- Br-Ph H

Et 4- EtO-Ph H

Et 2, 3- Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Et 3, 4- Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Et 3, 5-Me&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Et 2- Cl-3- Me-Ph H

Et 2- Cl-4- Me-Ph H

Et 3- Cl-4- Me-Ph H

Et 4- Cl-2- Me-Ph H

Et 4- Cl-3- Me-Ph H

Et 2, 4, 6-Me&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph H

Pr Et H

Pr n- Pr H

Pr i- Pr H

Pr s-Bu H

Pr t-Bu H

Pr CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt; H

Pr CF&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt; H

Pr 1- Me-3- Cl-Pyrazol-4- yl H

Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-3- yl H

Pr 1- Me-5-Cl-Pyrazol-4- yl H

Pr Ph H

Pr 2- Cl-Ph H

Pr 4- Cl-Ph H

Pr 2- F-Ph H

Pr 4- F-Ph H

Pr 2- Me-Ph H

Pr 4- Me-Ph H

Pr 4- Br-Ph H

Pr 2, 6-F&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Pr 2, 3- F&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Pr 2, 5-F&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Pr 3, 4- F&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;-Ph H

Pr 3,5-F<sub>2</sub>-Ph HPr 2,4-F<sub>2</sub>-Ph H

Pr 2-Br-Ph H

Br n-Pr H

Br i-Pr H

Br s-Bu H

Br t-Bu H

Br CF<sub>3</sub> HBr CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H

Br Ph H

Br 2-Cl-Ph H

Br 4-Cl-Ph H

Br 2-F-Ph H

Br 4-F-Ph H

Br 2-Me-Ph H

Br 4-Me-Ph H

Br 4-Br-Ph H

i-Pr i-Pr H

i-Pr s-Bu H

i-Pr t-Bu H

i-Pr CF<sub>3</sub> HPr 3, 5-F<sub>2</sub>-Ph HPr 2, 4- F<sub>2</sub>-Ph H

Pr 2- Br-Ph H

Br n- Pr H

Br i- Pr H

Br s-Bu H

Br t-Bu H

Br CF<sub>3</sub> HBr CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> H

Br Ph H

Br 2- Cl-Ph H

Br 4- Cl-Ph H

Br 2- F-Ph H

Br 4- F-Ph H

Br 2- Me-Ph H

Br 4- Me-Ph H

Br 4- Br-Ph H

i- Pr i- Pr H

i- Pr s-Bu H

i- Pr t-Bu H

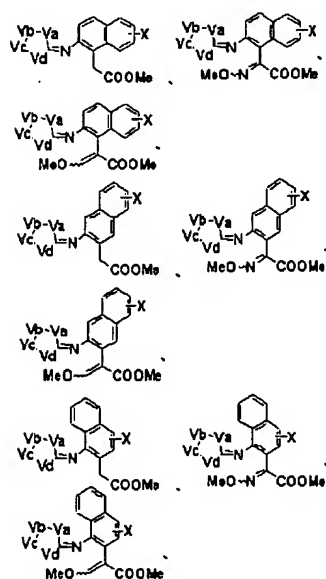
i- Pr CF<sub>3</sub> H

i-Pr			CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
i- Pr			CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
i-Pr			Ph	H
i- Pr			Ph	H
i-Pr			2-Cl-Ph	H
i- Pr			2 -Cl-Ph	H
i-Pr			4-Cl-Ph	H
i- Pr			4 -Cl-Ph	H
i-Pr			2-F-Ph	H

i- Pr			2 -F-Ph	H
i-Pr			4-F-Ph	H
i- Pr			4 -F-Ph	H
i-Pr			2-Me-Ph	H
i- Pr			2 -Me-Ph	H
i-Pr			4-Me-Ph	H
i- Pr			4 -Me-Ph	H
i-Pr			4-Br-Ph	H
i- Pr			4 -Br-Ph	H
i-Pr			2-Br-Ph	H
i- Pr			2 -Br-Ph	H
	[			

【0244】

【0244】



【化 66】

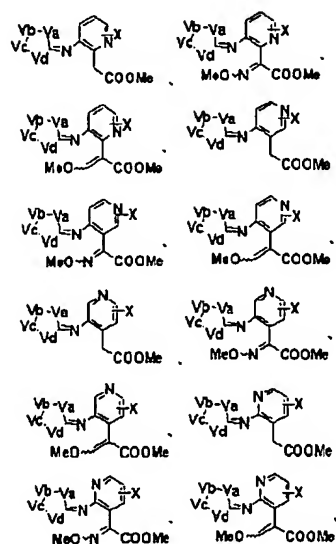
[Chemical Formula 66]

【0245】

【0245】

【化 67】

[Chemical Formula 67]

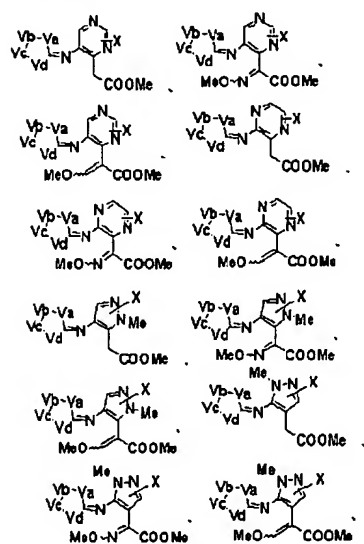


【0246】

[0246]

【化 68】

[Chemical Formula 68]

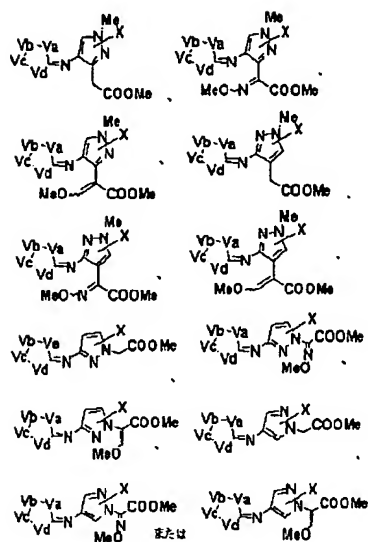


【0247】

[0247]

【化 69】

[Chemical Formula 69]



【0248】

【表 3】

-Va-Vb-Vc-Vd- X

-S-CH<sub>2</sub>-C(OH)(C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>)-N(Me)- H-S-CH(CH<sub>2</sub>Br)-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-S-S-CH=N- H

-S-S-C(Ph)=N- H

-S-S-C(CF<sub>3</sub>)=N- H-S-N(Me)-CH<sub>2</sub>-S- H-S-N(Ph)-CH<sub>2</sub>-S- H

-S-N(Me)-CH(Ph)-S- H

-N=N-C(=O)-O- H

-N=N-CH(Me)-O- H

-N=N-CH(Ph)-O- H

-S-O-CH=N- H

-S-O-C(Me)=N- H

-S-O-C(Ph)=N- H

-CH=CH-N(Me)-S- H

【0248】

[Table 3]

-Va-Vb-Vc-Vd - X

-S-CH<sub>2</sub>-C(OH)(C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>)-N(Me)-H-S-CH(CH<sub>2</sub>Br)-CH<sub>2</sub>-N(Me)-H

-S-S-CH=N- H

-S-S-C(Ph)=N- H

-S-S-C(CF<sub>3</sub>)=N- H-S-N(Me)-CH<sub>2</sub>-S- H-S-N(Ph)-CH<sub>2</sub>-S- H

-S-N(Me)-CH(Ph)-S- H

-N=N-C(=O)-O- H

-N=N-CH(Me)-O- H

-N=N-CH(Ph)-O- H

-S-O-CH=N- H

-S-O-C(Me)=N- H

-S-O-C(Ph)=N- H

-CH=CH-N(Me)-S- H



-CH=CH-N(Ph)-S- H	-CH=CH-N (Ph ) -S- H
-C(Me)=CH-N(Ph)-S- H	-C (Me ) =CH-N (Ph ) -S- H
-CH=C(Me)-N(Ph)-S- H	-CH=C (Me ) -N (Ph ) -S- H
-C(Me)=C(Me)-N(Ph)-S- H	-C (Me ) =C (Me ) -N (Ph ) -S- H
-CH=CH-N(Me)-O- H	-CH=CH-N (Me ) -O- H
-CH=CH-N(Ph)-O- H	-CH=CH-N (Ph ) -O- H
-C(Me)=CH-N(Ph)-O- H	-C (Me ) =CH-N (Ph ) -O- H
-CH=C(Me)-N(Ph)-O- H	-CH=C (Me ) -N (Ph ) -O- H
-C(Me)=C(Me)-N(Ph)-O- H	-C (Me ) =C (Me ) -N (Ph ) -O- H
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(Me)-O- H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N (Me ) -O- H
-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(Ph)-O- H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -O- H
-CH <sub>2</sub> -C(=O)-N(Ph)-O- H	-CH <sub>2</sub> -C ( =O ) -N (Ph ) -O- H
-CH=N-N(Me)-CH <sub>2</sub> - H	-CH=N- N (Me ) -CH <sub>2</sub> - H
-CH=N-N(Ph)-CH <sub>2</sub> - H	-CH=N- N (Ph ) -CH <sub>2</sub> - H
-CH=N-N(Ph)-C(=O)- H	-CH=N- N (Ph ) -C ( =O ) -H
-C(Me)=N-N(Ph)-C(=O)- H	-C (Me ) =N- N (Ph ) -C ( =O ) -H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-O- H	-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -O- H
-N(Me)-C(=O)-N(Ph)-O- H	-N (Me ) -C ( =O ) -N (Ph ) -O- H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-S- H	-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -S- H
-N(Me)-C(=O)-N(Ph)-S- H	-N (Me ) -C ( =O ) -N (Ph ) -S- H
-S-CH <sub>2</sub> -C(Ph)=N- H	-S-CH <sub>2</sub> -C (Ph ) =N- H
-S-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-N(Me)- H	-S-CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -N (Me ) -H
-S-C(=O)-N(Ph)-N(Me)- H	-S-C ( =O ) -N (Ph ) -N (Me ) -H
-O-CH <sub>2</sub> -C(Ph)=N- H	-O-CH <sub>2</sub> -C (Ph ) =N- H
-O-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-N(Me)- H	-O-CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -N (Me ) -H
-O-C(=O)-N(Ph)-N(Me)- H	-O-C ( =O ) -N (Ph ) -N (Me ) -H
-S-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- H	-S-CH (Ph ) -N (Me ) -N (Me ) -H
-O-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- H	-O-CH (Ph ) -N (Me ) -N (Me ) -H
-N=C(Me)-N=N- H	-N=C (Me ) -N=N- H
-N=C(Ph)-N=N- H	-N=C (Ph ) -N=N- H
-N=CH-CH=N- H	-N=CH-CH=N- H
-N=C(Ph)-CH=N- H	-N=C (Ph ) -CH=N- H
-S-N(Me)-CH <sub>2</sub> -N(Me)- H	-S-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -N (Me ) -H
-S-N(Ph)-CH <sub>2</sub> -N(Me)- H	-S-N (Ph ) -CH <sub>2</sub> -N (Me ) -H
-O-N(Me)-CH <sub>2</sub> -N(Me)- H	-O-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -N (Me ) -H

-O-N(Ph)-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)-N(Me)- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Ph)-N(Me)- H  
 -CH<sub>2</sub>-C(Ph)=N-N(Me)- H  
 -CH=C(Ph)-N(Me)-N(Me)- H  
 -CH=CH-N(Ph)-N(Me)- H  
 -CH=C(Ph)-N=N- H  
 -CH=N-C(Ph)=N- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N=N- H  
 -N(Me)-O-CH(Ph)-N(Me)- H  
 -O-CH<sub>2</sub>-C(Ph)=N- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H  
  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-O- H  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-S- H  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H  
 -CH<sub>2</sub>-S-C(=N-Ph)-N(Me)- H  
 -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H  
 -O-CH<sub>2</sub>-CH(Ph)-N(Me)- H  
 -O-CH=CH-N(Me)- H  
 -O-CH=CH(Ph)-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH(Ph)-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH=CH-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH=CH(Ph)-N(Me)- H  
 -S-CH=N-N(Me)- H  
 -S-C(Ph)=N-N(Me)- H  
 -S-CH<sub>2</sub>-N=N- H  
 -S-CH(Ph)-N=N- H  
 -O-CH=N-N(Me)- H  
 -O-C(Ph)=N-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH<sub>2</sub>-N(Me)-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- H  
  
 -O-N (Ph ) -CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -N (Me ) -H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N (Ph ) -N (Me ) -H  
 -CH<sub>2</sub>-C (Ph ) =N- N (Me ) -H  
 -CH=C (Ph ) -N (Me ) -N (Me ) -H  
 -CH=CH-N (Ph ) -N (Me ) -H  
 -CH=C (Ph ) -N=N- H  
 -CH=N- C (Ph ) =N- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N=N- H  
 -N (Me ) -O-CH (Ph ) -N (Me ) -H  
 -O-CH<sub>2</sub>-C (Ph ) =N- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S- H  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H  
  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-O- H  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-S- H  
 -CH=CH-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H  
 -CH<sub>2</sub>-S-C (=N- Ph ) -N (Me ) -H  
 -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H  
 -O-CH<sub>2</sub>-CH (Ph ) -N (Me ) -H  
 -O-CH=CH-N (Me ) -H  
 -O-CH=CH (Ph ) -N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH<sub>2</sub>-CH (Ph ) -N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH=CH-N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH=CH (Ph ) -N (Me ) -H  
 -S-CH=N- N (Me ) -H  
 -S-C (Ph ) =N- N (Me ) -H  
 -S-CH<sub>2</sub>-N=N- H  
 -S-CH (Ph ) -N=N- H  
 -O-CH=N- N (Me ) -H  
 -O-C (Ph ) =N- N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH<sub>2</sub>-N (Me ) -N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH (Ph ) -N (Me ) -N (Me ) -H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-N(Ph)-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH(Me)-N(Ph)-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH=N-N(Me)- H  
 -N(Me)-C(Ph)=N-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH=N-N(Me)- H  
 -N(Me)-CH=N-N(Me)- H  
 -N=CH-N(Me)-N(Me)- H  
 -N=C(Ph)-N(Me)-N(Me)- H  
 -N=CH-N(Me)-N(Me)- H  
 -N=CH-N(Ph)-N(Me)- H  
 -S-N=CH-N(Me)- H  
 -S-N=C(Ph)-N(Me)- H  
 -S-N(Me)-CH=N- H  
 -S-N(Ph)-C(Ph)=N- H  
 -S-N(Me)-C(Ph)=N- H

-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-N (Ph ) -N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH (Me ) -N (Ph ) -N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH=N- N (Me ) -H  
 -N (Me ) -C (Ph ) =N- N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH=N- N (Me ) -H  
 -N (Me ) -CH=N- N (Me ) -H  
 -N=CH-N (Me ) -N (Me ) -H  
 -N=C (Ph ) -N (Me ) -N (Me ) -H  
 -N=CH-N (Me ) -N (Me ) -H  
 -N=CH-N (Ph ) -N (Me ) -H  
 -S-N=CH-N (Me ) -H  
 -S-N=C (Ph ) -N (Me ) -H  
 -S-N (Me ) -CH=N- H  
 -S-N (Ph ) -C (Ph ) =N- H  
 -S-N (Me ) -C (Ph ) =N- H

-S-N(Ph)-CH=N- H

-S-N (Ph ) -CH=N- H

-O-N=CH-N(Me)- H

-O-N=CH-N (Me ) -H

-O-N=C(Ph)-N(Me)- H

-O-N=C (Ph ) -N (Me ) -H

-O-N(Me)-CH=N- H

-O-N (Me ) -CH=N- H

-O-N(Ph)-C(Ph)=N- H

-O-N (Ph ) -C (Ph ) =N- H

-O-N(Me)-C(Ph)=N- H

-O-N (Me ) -C (Ph ) =N- H

-O-N(Ph)-CH=N- H

-O-N (Ph ) -CH=N- H

-N(Me)-O-CH=N- H
-N (Me ) -O-CH=N- H
-N(Ph)-O-C(Ph)=N- H
-N (Ph ) -O-C (Ph ) =N- H
-N(Me)-O-C(Ph)=N- H
-N (Me ) -O-C (Ph ) =N- H
-N(Ph)-O-CH=N- H
-N (Ph ) -O-CH=N- H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -N=N- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -N=N <sub>2</sub> - N- H
-N(Me)-CH(Ph)-N=N- H
-N (Me ) -CH (Ph ) -N=N- H
-S-N=CH-S- H
-S-N=CH-S- H
-S-N=C(Ph)-S- H
-S-N=C (Ph ) -S- H
-O-CH=CH-O- H
-O-CH=CH-O- H
-O-C(Me)=CH-O- H
-O-C (Me ) =CH-O- H
-O-C(Ph)=CH-O- H
-O-C (Ph ) =CH-O- H
-O-C(Me)=C(Ph)-O- H
-O-C (Me ) =C (Ph ) -O- H

-O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O- H
-O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - - H
-O-CH <sub>2</sub> -CH(Ph)-O- H
-O-CH <sub>2</sub> -CH (2 - ) -O- H
-O-CH(Ph)-CH(Me)-O- H
-O-CH (Ph ) -CH (Me ) -O- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - - H
-S-CH <sub>2</sub> -CH(Ph)-O- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH (2 - ) -O- H
-S-CH(Ph)-CH(Me)-O- H
-S-CH (Ph ) -CH (Me ) -O- H
-S-CH(Me)-CH(Ph)-O- H
-S-CH (Me ) -CH (Ph ) -O- H
-S-CH(Ph)-CH <sub>2</sub> -O- H
-S-CH (Ph ) -CH <sub>2</sub> -O- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - - H
-S-CH <sub>2</sub> -CH(Ph)-S- H
-S-CH <sub>2</sub> -CH (2 - ) -S- H
-S-CH(Ph)-CH(Me)-S- H
-S-CH (Ph ) -CH (Me ) -S- H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - - H

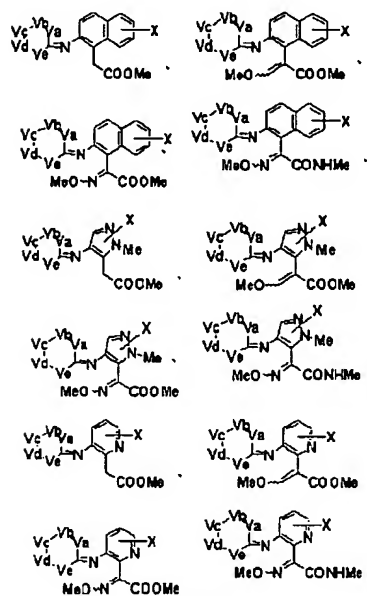
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -CH(Ph)-O- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -CH (2 - ) -O- H
-N(Me)-CH(Ph)-CH(Me)-O- H
-N (Me ) -CH (Ph ) -CH (Me ) -O- H
-N(Me)-CH(Me)-CH(Ph)-O- H
-N (Me ) -CH (Me ) -CH (Ph ) -O- H
-N(Me)-CH(Ph)-CH <sub>2</sub> -O- H
-N (Me ) -CH (Ph ) -CH <sub>2</sub> -O- H
-CH <sub>2</sub> -N=CH-S- H
-CH <sub>2</sub> -N=CH-S- H
-CH <sub>2</sub> -N=C(Ph)-S- H
-CH <sub>2</sub> -N=C2- h) -S- H
-CH <sub>2</sub> -S-CH=N- H
-CH <sub>2</sub> -S-CH=N- H
-CH <sub>2</sub> -S-C(Ph)=N- H
-CH <sub>2</sub> -S-C2- h) =N- H
-CH <sub>2</sub> -N(Me)-CH <sub>2</sub> -S- H
-CH <sub>2</sub> -N (Me ) -CH <sub>2</sub> -S- H
-CH <sub>2</sub> -N(Me)-CH(Ph)-S- H
-CH <sub>2</sub> -N (Me ) -CH (Ph ) -S- H
-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-CH <sub>2</sub> -S- H
-CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -CH <sub>2</sub> -S- H
-CH <sub>2</sub> -N(Ph)-CH(Ph)-S- H
-CH <sub>2</sub> -N (Ph ) -CH (Ph ) -S- H

〔第4表〕

{Table 4}

【0249】

[0249]



【化 70】

[Chemical Formula 70]

【0250】

[0250]

【表 4】

[Table 4]

-Va-Vb-Vc-Vd-Ve- X

-Va-Vb-Vc-Vd -Ve- X

$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{N}(\text{Ph})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{N}(\text{Ph})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Ph})=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-S-CH_2-CH_2-C(Ph)=N-N(Me)-H$$
$$-\text{S}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{N}(\text{Me})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{N}(\text{Me})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{N}(\text{Ph})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{N}(\text{Ph})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\dot{\text{C}}\text{H}=\text{C}(\text{Me})-\text{N}(\text{Ph})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$-\text{S}-\text{CH}=\text{C}(\text{Me})-\text{N}(\text{Ph})-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$
$$\text{-S-C(=O)-C(Me)=N-N(Me)-H}$$
$$-\text{S}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{N}(\text{Me})-\text{H}$$

-S-C(=O)-C(Ph)=N-N(Me)- H

-CH<sub>2</sub>-S-CH=CH-N(Me)- H

-N=CH-N=C(F)-N(Me)- H

-N=CH-N=C(Cl)-N(Me)- H

-N=CH-N=C(Br)-N(Me)- H

-N=CH-N=C(Ph)-N(Me)- H

-N=CH-N=C(OPh)-N(Me)- H

-N=CH-N=CH-N(Et)- H

-N=CH-N=CH-N(Pr)- H

-N=CH-N=C(CF<sub>3</sub>)-N(Me)- H

-N=C(Cl)-N=CH-N(Me)- H

-N=CH-N=CH-N(Me)- H

-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H

-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=CH-S- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-C(Ph)=CH-S- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=C(Ph)-S- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=CH-O- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-C(Ph)=CH-O- H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=C(Ph)-O- H

-N=CH-CH=CH-S- H

-N=CH-C(Ph)=CH-S- H

-N=CH-CH=C(Ph)-S- H

-N=CH-CH=C(Ph)-S- H

-N=CH-CH=CH-O- H

-N=CH-CH=CH-O- H

-N=CH-C(Ph)=CH-O- H

-N=CH-C(Ph)=CH-O- H

-N=CH-CH=C(Ph)-O- H

-N=CH-CH=C(Ph)-O- H

-S-C(=O)-C(Ph)=N-N(Me)-H

-CH<sub>2</sub>-S-CH=CH-N(Me)-H

-N=CH-N=C(F)-N(Me)-H

-N=CH-N=C(Cl)-N(Me)-H

-N=CH-N=C(Br)-N(Me)-H

-N=CH-N=C(Ph)-N(Me)-H

-N=CH-N=C(OPh)-N(Me)-H

-N=CH-N=CH-N(Et)-H

-N=CH-N=CH-N(Pr)-H

-N=CH-N=C(CF<sub>3</sub>)-N(Me)-H

-N=C(Cl)-N=CH-N(Me)-H

-N=CH-N=CH-N(Me)-H

-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-H

-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=CH-S-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-C(Ph)=CH-S-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=C(Ph)-S-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=CH-O-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-C(Ph)=CH-O-H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-CH=C(Ph)-O-H

-N=CH-CH=CH-S-H

-N=CH-C(Ph)=CH-S-H

-N=CH-CH=C(Ph)-S-H



-S-CH <sub>2</sub> -C(=O)-N(Me)-N(Me)- H
= 2 --N (Me ) -N (Me ) -H -S-CH <sub>2</sub> -C
-S-CH <sub>2</sub> -C(=O)-NPh-N(Me)- H
= 2 --NPh-N (Me ) -H -S-CH <sub>2</sub> -C
-S-CH=CH-CH(Ph)-N(Me)- H
-S-CH=CH-CH (Ph ) -N (Me ) -H
-CH=CH-CH=C(Ph)-N(-OMe)- H
-CH=CH-CH=C (Ph ) -N (-OMe ) -H
-CH=CH-CH=C(F)-N(-OMe)- H
-CH=CH-CH=C (F ) -N (-OMe ) -H
-CH=CH-CH=C(Cl)-N(-OMe)- H
-CH=CH-CH=C (Cl ) -N (-OMe ) -H
-CH=CH-CH=C(-OPh)-N(-OMe)- H
-CH=CH-CH=C (-OPh ) -N (-OMe ) -H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -N(Me)- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -N (Me ) -H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -S-CH(Ph)-N(Me)- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -S-CH (Ph ) -N (Me ) -H
-N(Me)-CH=CH-CH=N- H
-N (Me ) -CH=CH-CH=N- H
-N(Me)-C(Ph)=CH-CH=N- H
-N (Me ) -C (Ph ) =CH-CH=N- H
-N(Me)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(Me)- H
-N (Me ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - H <sub>2</sub> - (Me ) -H

-N(Me)-CH(Ph)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-N (Me ) -CH (Ph ) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- (Me ) -H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H<sub>2</sub>- (Me ) -H

-O-CH(Ph)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-O-CH (Ph ) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- (Me ) -H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H<sub>2</sub>- (Me ) -H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(Ph)-N(Me)- H

-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H (2 - ) -N (Me ) -H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H<sub>2</sub>- (Me ) -H

-S-CH(Ph)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-S-CH (Ph ) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- (Me ) -H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H<sub>2</sub>- (Me ) -H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(Ph)-N(Me)- H

-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- H (2 - ) -N (Me ) -H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-N(Me)-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-N(Me)-CH(Ph)-N(Me)- H

-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-N (Me ) -CH (Ph ) -N (Me ) -H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-N (Me ) -H

-N(Me)-CH<sub>2</sub>-O-CH(Ph)-N(Me)- H

-N (Me ) -CH<sub>2</sub>-O-CH (Ph ) -N (Me ) -H

-S-CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>-N(Me)- H

-S-CH<sub>2</sub>-CH=2- 2-N (Me ) -H

-S-CH<sub>2</sub>-CH=CH(Ph)-N(Me)- H

-S-CH<sub>2</sub>-CH=2- (Ph ) -N (Me ) -H

-S-CH=CH<sub>2</sub>-N(Me)-N(Me)- H

-S-CH=CH<sub>2</sub>-N (Me ) -N (Me ) -H

-S-CH=CH<sub>2</sub>-N(Ph)-N(Me)- H

-S-CH=CH<sub>2</sub>-N (Ph ) -N (Me ) -H

〔第5表〕

{ Table 5 }

〔0251〕

[0251]

〔表 5〕

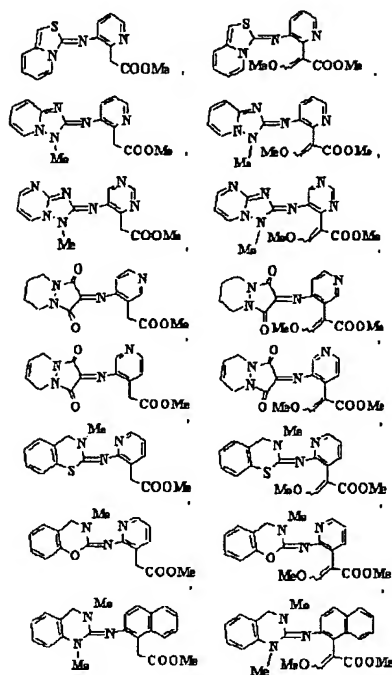
[Table 5]

〔0252〕

[0252]

〔化 71〕

[Chemical Formula 71]

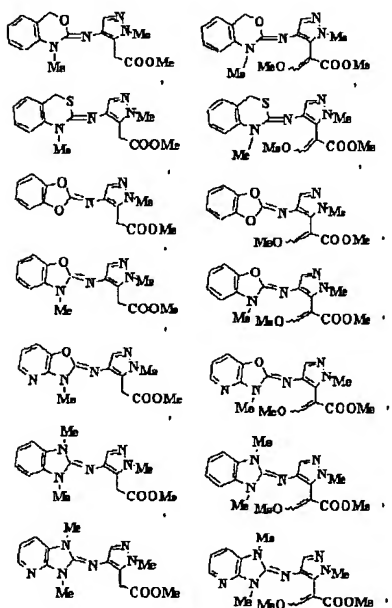


【0253】

[0253]

【化 72】

[Chemical Formula 72]

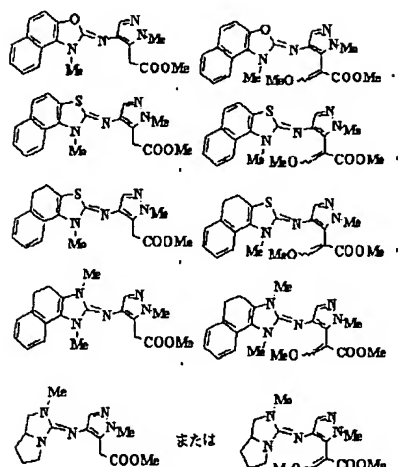


【0254】

[0254]

【化 73】

[Chemical Formula 73]



【0255】

本発明化合物を殺菌剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤および分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスポエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤およびゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。

また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

【0256】

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

【0257】

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘ

【0255】

When application it does with the compound of this invention as microbicide, it mixes with the suitable solid carrier or liquid carrier usually, adding boundary surfactant, permeant, spreading agent, thickener, antifreeze, binder, blocking preventing agent, disintegrating agent and decomposition-preventing agent etc furthermore with desire, with formulation of arbitrary form such as liquid, emulsion, wettable, water soluble, granule wettable, granule water soluble, suspension, emulsifier, suspoemulsion, microemulsion, powder, granule and gel agent offering/accompanying it is possible to utility.

In addition, from viewpoint of labor reduction and safety improvement, enclosing formulation of above-mentioned arbitrary form into water solubility packaging, it is possible also to offer.

【0256】

As solid carrier, for example quartz, kaolinite, pyrophyllite (DANA 71.2.1.1), sericite (DANA 71.2.2a.1), talc, bentonite (DANA 71.3.1a.1-2), acidic clay, attapulgite, zeolite and silicon algae earth or other natural mineral, you can list calcium carbonate, ammonium sulfate, sodium sulfate and potassium chloride or other inorganic salts, synthetic silicic acid and synthetic silicic acid salt.

【0257】

As liquid carrier, for example ethyleneglycol, propylene glycol and isopropanol or other alcohols, xylene, alkylbenzene and you can list alkyl naphthalene or other aromatic hydrocarbons, butyl cellosolve or other ethers, cyclohexanone or other ketones, gamma-butyrolactone or other

キサノン等のケトン類、 $\gamma$ -ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

【0258】

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0259】

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

【0260】

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。

また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0261】

また、本発明化合物を農薬として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と混合施用してもよい。

【0262】

特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施

esters, N- methyl pyrrolidone, N- octyl pyrrolidone or other acyl amides, soybean oil, rape seed oil, cottonseed oil and castor oil or other vegetable oil and water.

【0258】

These solid and liquid carrier, even when using with alone may jointly use 2 kinds or more.

【0259】

As boundary surfactant, you can list salt, polyoxyethylene alkyl aryl ether sulfuric acid and phosphate, polyoxyethylene styryl phenyl ether sulfuric acid and the phosphate, polycarboxylic acid salt and polystyrene sulfonate or other anionic surfactant, alkyl amine salt and alkyl quaternary ammonium salt or other cationic surfactant and amino acid type and betaine type or other amphoteric surfactant of the formalin condensate of salt, alkyl naphthalene sulfonic acid of formalin condensate of for example polyoxyethylene alkyl ether, polyoxyethylene alkyl aryl ether, polyoxyethylene styryl phenyl ether, polyoxyethylene polyoxypropylene block copolymer, polyoxyethylene fatty acid ester, sorbitan fatty acid ester and polyoxyethylene sorbitan fatty acid ester or other nonionic surfactant, alkyl sulfonate, alkylbenzene sulfonate, lignin sulfonate, alkyl sulfosuccinic acid salt, naphthalene sulfonate, alkyl naphthalene sulfonate, naphthalene sulfonic acid.

【0260】

content of these boundary surfactant is not something which especially is limited. Vis-a-vis formulation 100 parts by weight of this invention, range of usually 0.05 - 20 parts by weight is desirable.

In addition, these boundary surfactant, even when using with alone may jointly use 2 kinds or more.

【0261】

In addition, when the compound of this invention you use as pesticide, herbicide, various insecticide, miticide, nematocide, microbicide, plant growth regulator, synergistic agent, fertilizer, soil conditioner etc of other kind and mixed application it is possible to do at time of according to need formulation or time of scattering fabric.

【0262】

Especially, with decrease of application dose enlargement of

用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺菌スペクトラムの拡大や、より高い殺菌効果が期待できる。

この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。

本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック(Farm Chemicals Handbook)2001 年版に記載されている化合物等がある。

具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

【0263】

殺菌剤:

アシベンゾラル(acibenzolar)、  
 アムプロピルホス(ampropyfos)、  
 アニラジン(anilazine)、  
 アザコナゾール(azaconazole)、  
 アゾキシストロビン(azoxystrobin)、  
 ベナラキシル(benalaxyl)、  
 ベノダニル(benodanil)、  
 ベノミル(benomyl)、  
 ベンザマクリル(benzamacril)、  
 ビナパクリル(binapacryl)、  
 ビフェニル(biphenyl)、  
 ビテルタノール(bitertanol)、  
 ベトキサジン(bethoxazine)、  
 ボルドー液(bordeaux mixture)、  
 ブラスタサイジン-S(blasticidin-S)、  
 ブロモコナゾール(bromoconazole)、  
 ブピリメート(bupirimate)、  
 ブチオベート(buthiobate)、  
 カルシウムポリスルフィド(calcium polysulfide)、  
 キャプタフォル(captafol)、  
 キャプタン(captan)、  
 カッパーオキシクロリド(copper oxychloride)、  
 カルプロパミド(carpropamid)、

fungicidal spectrum and, you can expect a higher microbicidal effect with synergistic action of cost reduction, mixed chemical other pesticide or plant hormone and by mixed application doing.

this occasion, also combination with public knowledge pesticide of multiple is possible simultaneously.

for example Farm Chemicals Handbook (Farm Chemicals handbook ) there is a compound etc which is stated in 2001 year edition the compound of this invention and as types of pesticide which mixed use is done.

If generic name is illustrated concretely, as follows is, but it is not something which is always limited in only these.

【0263】

microbicide :

[ashibenzoraaru ] (acibenzolar )  
 [amupuropiruhosu ] (ampropyfos )  
 anilazine (anilazine ),  
 azaconazole (azaconazole ),  
 azoxystrobin (azoxystrobin ),  
 benalaxyl (benalaxyl ),  
 [benodaniru ] (benodanil )  
 benomyl (benomyl ),  
 [benzamakuriru ] (benzamacril )  
 binapacryl (binapacryl ),  
 biphenyl (biphenyl ),  
 bitertanol (bitertanol ),  
 [betokisajin ] (bethoxazine )  
 Bordeaux liquid (bordeaux mixture ),  
 blasticidin -S (blasticidin-S ),  
 bromo conazole (bromoconazole ),  
 bupirimate (bupirimate ),  
 buthiobate (buthiobate ),  
 calcium polysulfide (calcium polysulfide ),  
 [kyaputafooru ] (captafol )  
 captan (captan ),  
 kappa oxy chloride (copper oxychloride ),  
 carpropamid (carpropamid ),

カルベンダジン(carbendazim)、  
カルボキシ(carboxin)、  
キノメチオネート(chinomethionat)、  
クロベンチアゾン(chlobenthiazone)、  
クロルフェナゾール(chlorfenazol)、  
クロロネブ(chloroneb)、  
クロロタロニル(chlorothalonil)、  
クロゾリネート(chlozolate)、  
クフラネブ(cufraneb)、  
シモキサニル(cymoxanil)、  
シプロコナゾール(cyproconazol)、  
シプロジニル(cyprodinil)、  
シプロフラム(cyprofuram)、  
デバカルブ(debacarb)、  
ジクロロフェン(dichlorophen)、  
ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、  
ジクロフラニド(diclhlofluaniid)、  
ジクロメジン(diclomedine)、  
ジクロラン(dicloran)、  
ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、  
ジクロシメット(diclocymet)、  
ジフェノコナゾール(difenoconazole)、  
ジフルメトリン(diflumetorim)、  
ジメチリモール(dimethirimol)、  
ジメトモルフ(dimethomorph)、  
ジニコナゾール(diniconazole)、  
ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、  
ジノカップ(dinocap)、  
ジフェニルアミン(diphenylamine)、  
ジピリチオン(dipyrrithione)、  
ジタリムホス(ditalimfos)、  
ジチアノン(dithianon)、  
ドデモルフ(dodemorph)、  
ドジン(dodine)、  
ドラゾクソロン(drazoxolon)、

[karubendajin ] (carbendazim )  
carboxin (carboxin ),  
quinomethionate (chinomethionat ),  
[kurobenthiazon ] (chlobenthiazone )  
[kurorufenazooru ] (chlorfenazol )  
chloroneb (chloroneb ),  
chlorthalonil (chlorothalonil ),  
[kurozorineeto ] (chlozolate )  
[kufuranebu ] (cufraneb )  
cymoxanil (cymoxanil ),  
cyproconazole (cyproconazol ),  
cyprodinil (cyprodinil ),  
cyprofuram (cyprofuram ),  
[debakarubu ] (debacarb )  
dichlorophene (dichlorophen ),  
diclobutrazol (diclobutrazol ),  
[jikurofuranido ] (diclhlofluaniid )  
diclomezine (diclomedine ),  
[jikuroran ] (dicloran )  
diethofencarb (diethofencarb ),  
[jikuroshimetto ] (diclocymet )  
difenconazole (difenoconazole ),  
[jifurumetorin ] (diflumetorim )  
dimethirimol (dimethirimol ),  
dimethomorph (dimethomorph ),  
diniconazole (diniconazole ),  
diniconazole -M (diniconazole-M ),  
dinocap (dinocap ),  
diphenylamine (diphenylamine ),  
dipyrrithione (dipyrrithione ),  
[jitarimuhosu ] (ditalimfos )  
dithianon (dithianon ),  
[dodemorufu ] (dodemorph )  
dodine (dodine ),  
[dorazokusoron ] (drazoxolon )



エデフェノホス(edifenphos)、	[edefenohosu ] (edifenphos )
エポキシコナゾール(epoxiconazole)、	epoxyconazole (epoxiconazole ),
エタコナゾール(etaconazole)、	etaconazole (etaconazole ),
エチリモル(ethirimol)、	[echirimoru ] (ethirimol )
エトリジアゾール(etridiazole)、	[etorijiazooru ] (etridiazole )
ファミキサドン(famoxadone)、	[famokisadon ] (famoxadone )
フェナリモル(fenarimol)、	fenarimol (fenarimol ),
フェブコナゾール(febuconazole)、	[febukonazooru ] (febuconazole )
フェンフラム(fenfuram)、	[fenfuramu ] (fenfuram )
フェンピクロニル(fenpiclonil)、	fenpiclonil (fenpiclonil ),
フェンプロピジン(fenpropidin)、	fenpropidin (fenpropidin ),
フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、	fenpropimorph (fenpropimorph ),
フェンチン(fentin)、	fentin (fentin ),
フェルバン(ferbam)、	[feruban ] (ferbam )
フェリムゾン(ferimzone)、	ferimzone (ferimzone ),
フルアジナム(fluzinam)、	fluazinam (fluazinam ),
フルジオキシニル(fludioxonil)、	fludioxonil (fludioxonil ),
フルオロイミド(fluoroimide)、	fluoro imide (fluoroimide ),
フルキンコナゾール(fluquinconazole)、	fluquinconazole (fluquinconazole ),
フルシラゾール(flusilazole)、	flusilazole (flusilazole ),
フルスルファミド(flusulfamide)、	flusulfamide (flusulfamide ),
フルトラニル(flutolanil)、	flutolanil (flutolanil ),
フルトリアフォール(flutriafol)、	[furutoriafooru ] (flutriafol )
フォルペット(folpet)、	folpet (folpet ),
フォセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminium)、	[fosechiru ] -al * Niu * (fosetyl-aluminium ),
フベリダゾール(fuberidazole)、	[fuberidazooru ] (fuberidazole )
フララキシル(furalaxyl)、	furalaxyl (furalaxyl ),
フェナミドン(fenamidon)、	[fenamidon ] (fenamidone )
フェンヘキサミド(fenhexamid)、	[fenhekisamido ] (fenhexamid )
グアザチン(guazatine)、	guazatine (guazatine ),
ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)、	hexachlorobenzene (hexachlorobenzene ),
ヘキサコナゾール(hexaconazole)、	hexaconazole (hexaconazole ),
ヒメキサゾール(hymexazol)、	hymexazole (hymexazol ),
イマザリル(imazalil)、	imazalil (imazalil ),
イミベンコナゾール(imibenconazole)、	imibenconazole (imibenconazole ),

イミノクタジン(iminoctadine)、	iminocetadine (iminocetadine ),
イブコナゾール(ipconazole)、	ipconazole (ipconazole ),
イプロベンホス(iprobenfos)、	iprobenfos (iprobenfos ),
イプロジオン(iprodione)、	iprodione (iprodione ),
イソプロチオラン(isoprothiolane)、	isoprothiolane (isoprothiolane ),
イプロバリカルブ(iprovalicarb)、	[ipurobarikarubu ] (iprovalicarb )
カスガマイシン(kasugamycin)、	kasugamycin (kasugamycin ),
クレソキシム-メチル(kresoxim-methyl)、	kresoxim -methyl (kresoxim-methyl ),
マンカツパー(mancopper)、	man kappa (mancopper ),
マンコゼブ(mancozeb)、	mancozeb (mancozeb ),
マンネブ(maneb)、	maneb (maneb ),
メパニピリム(mepanipirim)、	mepanipirim (mepanipirim ),
メプロニル(mepronil)、	mepronil (mepronil ),
メタラキシル(metalaxyl)、	metalaxyl (metalaxyl ),
メトコナゾール(metconazole)、	metconazole (metconazole ),
メチラム(metiram)、	[mechiramu ] (metiram )
メトミノストロビン(metominostrobin)、	[metominosutorobin ] (metominostrobin )
ミクロブタニル(myclobutanil)、	microbutanil (myclobutanil ),
ナバム(nabam)、	[nabamu ] (nabam )
ニッケルビス(ジメチルジチオカーバメート)(nickel bis(dimethyldithiocarbamate))、	nickel bis (dimethyldithiocarbamate ), nickel bis (dimethyl dithiocarbamate )
ニトロタル-イソプロピル(nitrothal-isopropyl)、	nitro tar -isopropyl (nitrothal-isopropyl ), jp10 ants mole
ヌアリモル(nuarimol)、オクチリノン(octhilinone)、	(nuarimol ), octi jp9 non (octhilinone ), ofurace (ofurace ),
オフレース(ofurace)、オキサジキシル(oxadixyl)、	oxadixyl (oxadixyl ), oxycarboxin (oxycarboxin ),
オキシカルボキシン(oxycarboxin)、	[okipokonazoorufumaaru ] acid salt (oxpoconazole
オキポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole fumarate)、	fumarate ), pefurazoate (pefurzoate ), penconazole
ペフラゾエート(pefurzoate)、	(penconazole ), pencycuron (pencycuron ), phthalide
ペンコナゾール(penconazole)、	(phthalide ), [piperarin ] (piperalin ), polyoxins (polyoxins ),
ペンシクロン(pencycuron)、	probenazole (probenazole ), prochloraz (prochloraz ),
フタライド(phthalide)、	procymidone (procymidone ), propamocarb hydrochloride
ピペラリン(piperalin)、	(propamocarb hydrochloride ), propiconazole
ポリオキシン(polyoxins)、	(propiconazole ), propineb (propineb ), pyrazophos
プロベナゾール(probenazole)、	(pyrazophos ), pyrifeno (pyrifeno ), [pirimetaniru ]
プロクロラズ(prochloraz)、	(pyrimethanil ), [pirokyuron ] (pyroquilon ), quinoxifen
プロシミドン(procymidone)、	(quinoxifen ), quitozene (quitozene ), sulfur (sulfur ),
プロパモカルブ塩酸塩(propamocarb hydrochloride)、	sprioxamine (spiroxamine ), tebuconazole (tebuconazole ),
プロピコナゾール(propiconazole)、	[tekunazen ] (tecnazene ), tetraconazole (tetraconazole ),
プロピネブ(propineb)、	tiabendazole (tiabendazole ), thifluzamide (thifluzamide ),
ピラゾホス(pyrazophos)、	thiophanate -methyl (thiophanate-methyl ), jp8 ram (thiram ),
ピリフェノックス(pyrifeno)、	tolclofos -methyl (tolclofos-methyl ), [torirufuranido ]
ピリメタニル(pyrimethanil)、	(tolylfluamid ), triadimefon (triadimefon ), triadimenol
ピロキロン(pyroquilon)、	(toriadimenol ), [toriazokishido ] (triazoxide ), tricyclazole
キノキシフェン(quinoxifen)、	(tricyclazole ), tridemorph (tridemorph ), triflumizole
キントゼン(quitozene)、	
硫黄(sulfur)、	
スピロキサミン(spiroxamine)、	
テブコナゾール(tebuconazole)、	
テクナゼン(tecnazene)、	
テトラコナゾール(tetraconazole)、	
チアベンダゾール(thiabendazole)、	
チフルザミド(thifluzamide)、	
チオファネート-メチル(thiophanate-methyl)、	
チラ	

ム (thiram) 、トルクロホス - メチル (tolclofos-methyl) 、トリルフラニド (tolylfluand) 、トリアジメホン (triadimefon) 、トリアジメノール (toriadimenol) 、トリアゾキシド (triazoxide) 、トリシクラゾール (tricyclazole) 、トリデモルフ (tridemorph) 、トリフルミゾール (trifluzimazole) 、トリホリン (triforine) 、トリチコナゾール (triticonazole) 、バリダマイシン (validamycin) 、ビンクロゾリン (vinclozolin) 、ジネブ (zineb) 及びジラム (ziram) 等。

## 【0264】

殺バクテリア剤: ストレプトマイシン (streptomycin) 、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 及びオキシリニックアシド (oxolinic acid) 等。

## 【0265】

殺線虫剤: アルドキシカルブ (aldoxycarb) 、フォスチアゼート (fosthiazate) 、フォスチエタン (fosthietan) 、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミホス (fenamiphos) 等。

## 【0266】

殺ダニ剤: アミトラズ (amitraz) 、ブロモプロピレート (bromopropylate) 、チノメチオネート (chinomethionat) 、クロロベンジラート (chlorobenzilate) 、クロフェンテジン (clofentazine) 、サイヘキサチン (cyhexatine) 、ジコフォール (dicofol) 、ジエノクロール (dienochlor) 、エトキサゾール (etoxazole) 、フェナザキン (fenazaquin) 、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide) 、フェンプロパトリン (fenpropathrin) 、フェンプロキシメート (fenproximate) 、ハルフェンプロックス (hexythiazox) 、ミルベメクチン (milbemectin) 、プロパルギット (propargite) 、ピリダベン (pyridaben) 、ピリミジフェン (pyrimidifen) 及びテブフェンピラド (tebufenpyrad) 等。

## 【0267】

殺虫剤:

アバメクチン (abamectin) 、  
アセフェート (acephate) 、  
アセタミピリド (acetamiprid) 、  
アジンホス - メチル (azinphos-methyl) 、  
ベンジオカルブ (bendiocarb) 、  
ベンフラカルブ (benfuracarb) 、  
ベンスルタップ (bensultap) 、

(trifluzimazole) , triforine (triforine) , tri jp8 conazole (triticonazole) , validamycin (validamycin) , vinclozolin (vinclozolin) , zineb (zineb) and ziram (ziram) etc.

## 【0264】

Shooting bacteria agent : streptomycin (streptomycin) , oxytetracycline (oxytetracycline) and oxo jp9 nick acid (oxolinic acid) etc.

## 【0265】

nematicide : [arudokishikarubu] (aldoxycarb) , [fosuchiazate] (fosthiazate) , [fosuchietan] (fosthietan) , oxamyl (oxamyl) and fenamiphos (fenamiphos) etc.

## 【0266】

miticide : amitraz (amitraz) , bromopropylate (bromopropylate) , [chinomechioneeto] (chinomethionat) , chloro benzylate (chlorobenzilate) , clofentazine (clofentazine) , [saihekisachin] (cyhexatine) , dicofol (dicofol) , dieno chloro (dienochlor) , etoxazole (etoxazole) , fenazaquin (fenazaquin) , [fenbutachinokishido] (fenbutatin oxide) , fenpropathrin (fenpropathrin) , [fenpurokishimeeto] (fenproximate) , halfenprox (halfenprox) , hexythiazox (hexythiazox) , milbemectin (milbemectin) , propargite (propargite) , pyridaben (pyridaben) , pyrimidifen (pyrimidifen) and tebufenpyrad (tebufenpyrad) etc.

## 【0267】

insecticide :

abamectin (abamectin) ,  
acephate (acephate) ,  
acetamiprid (acetamiprid) ,  
[ajinhosu] -methyl (azinphos-methyl) ,  
bendiocarb (bendiocarb) ,  
benfuracarb (benfuracarb) ,  
bensultap (bensultap) ,

ビフェントリン(bifenthrin)、  
ブプロフェジン(buprofezin)、  
ブトカルボキシシン(butocarboxim)、  
カルバリル(carbaryl)、  
カルボフラン(carbofuran)、  
カルボスルファン(carbosulfan)、  
カルタップ(cartap)、  
クロルフェナピル(chlorfenapyr)、  
クロルピリホス(chlorpyrifos)、  
クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、  
クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、  
クロチアニジン(clothianidin)、  
クロマフェノジド(chromafenozide)、  
クロピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、  
サイフルトリン(cyfluthrin)、  
ベータ-サイフルトリン(beta-cyfluthrin)、  
サイパーメスリン(cypermethrin)、  
シロマジン(cyromazine)、  
サイハロトリン(cyhalothrin)、  
ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、  
デルタメトリン(deltamethrin)、  
ジアフェンチウロン(diafenthion)、  
ダイアジノン(diazinon)、  
ジアクロデン(diaclofen)、  
ジフルベンズロン(diflubenzuron)、  
ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、  
ジオフェノラン(diofenolan)、  
ジスルフoton(disulfoton)、  
ジメトエート(dimethoate)、  
EPN、  
エスフェンバレレート(esfenvalerate)、  
エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、  
エチプロール(ethiprole)、  
エトフェンプロックス(etofenprox)、  
エトリムホス(etrimfos)、

bifenthrin (bifenthrin ),  
buprofezin (buprofezin ),  
buto carboxin (butocarboxim ),  
carbaryl (carbaryl ),  
carbofuran (carbofuran ),  
carbosulfan (carbosulfan ),  
cartap (cartap ),  
chlorfenapyr (chlorfenapyr ),  
chlorpyrifos (chlorpyrifos ),  
chlorfenvinphos (chlorfenvinphos ),  
chlorfluazuron (chlorfluazuron ),  
[kurochianijin ] (clothianidin )  
chromafenozide (chromafenozide ),  
[kuropirihosu ] -methyl (chlorpyrifos-methyl ),  
[saifurutorin ] (cyfluthrin )  
beta - [saifurutorin ] (beta-cyfluthrin ),  
cypermethrin (cypermethrin ),  
cyromazine (cyromazine ),  
[saiharotorin ] (cyhalothrin )  
lambda cyhalothrin (lambda -cyhalothrin ),  
deltamethrin (deltamethrin ),  
diafenthion (diafenthion ),  
diazinon (diazinon ),  
diaclofen (diaclofen ),  
diflubenzuron (diflubenzuron ),  
dimethylvinphos (dimethylvinphos ),  
[jiofenoran ] (diofenolan )  
disulfoton (disulfoton ),  
dimethoate (dimethoate ),  
EPN ,  
esfenvalerate (esfenvalerate ),  
ethiofencarb (ethiofencarb ),  
[echipurooru ] (ethiprole )  
ethofenprox (etofenprox ),  
etrimfos (etrimfos ),

フェニトロチオン(fenitrothion)、  
 フェノブカルブ(fenobucarb)、  
 フェノキシカーブ(fenoxycarb)、  
 フェンプロパトリン(fenpropathrin)、  
 フェンバレレート(fenvalerate)、  
 フィプロニル(fipronil)、  
 フルサイスリネート(flucythrinate)、  
 フルフェノクスウロン(flufenoxuron)、  
 フルフェンプロックス(flufenprox)、  
 タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、  
 ホノホス(fonophos)、  
 フォルメタネート(formetanate)、  
 フォルモチオン(formothion)、  
 フラチオカルブ(furathiocarb)、  
 ハロフェノジド(halofenozide)、  
 ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、  
 ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、  
 イミダクロプリド(imidacloprid)、  
 イソフェンホス(isofenphos)、  
 インドキサカルブ(indoxacarb)、  
 イソプロカルブ(isoprocab)、  
 イソキサチオン(isoxathion)、  
 ルフェヌウロン(lufenuron)、

マラチオン(malathion)、メタルデヒド(metaldehyde)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メタクリホス(methacrifos)、メタルカルブ(metalcarb)、メソミル(methomyl)、メソプレン(methoprene)、メトキシクロール(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、モノクロトホス(monocrotophos)、ムスカルーレ(muscalure)、ニテンピラム(nitenpyram)、オメトエート(omethoate)、オキシデメトン-メチル(oxydemeton-methyl)、オキサミル(oxamyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、パーメスリン(permethrin)、フェントエート(phenthoate)、フォキシム(phoxim)、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet)、ホスファミドン(phosphamidon)、ピリミカルブ(pirimicarb)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス

fenitrothion (fenitrothion ),  
 fenobucarb (fenobucarb ),  
 fenoxycarb (fenoxycarb ),  
 fenpropathrin (fenpropathrin ),  
 fenvalerate (fenvalerate ),  
 fipronil (fipronil ),  
 flucythrinate (flucythrinate ),  
 [furufenokusuuron ] (flufenoxuron )  
 [furufenpurokkusu ] (flufenprox )  
 [tau ] -fluvalinate (tau-fluvalinate ),  
 [honohosu ] (fonophos )  
 [forumetaneeto ] (formetanate )  
 formothion (formothion ),  
 furathiocarb (furathiocarb ),  
 [harofenozido ] (halofenozide )  
 hexaflumuron (hexaflumuron ),  
 hydramethylnon (hydramethylnon ),  
 imidacloprid (imidacloprid ),  
 isofenphos (isofenphos ),  
 indoxacarb (indoxacarb ),  
 isoprocab (isoprocab ),  
 isoxathion (isoxathion ),  
 [rufenuuron ] (lufenuron )  
 malathion (malathion ), [metarudehido ] (metaldehyde ),  
 [metamidohosu ] (methamidophos ), methidathion  
 (methidathion ), [metakurihosu ] (methacrifos ),  
 [metarukarubu ] (metalcarb ), methomyl (methomyl ),  
 methoprene (methoprene ),methoxy chloro (methoxychlor ),  
 methoxyfenozide (methoxyfenozide ), monocrotophos  
 (monocrotophos ), [musukaruure ] (muscalure ), nitenpyram  
 (nitenpyram ), [ometoeeto ] (omethoate ), oxydemeton  
 -methyl (oxydemeton-methyl ), oxamyl (oxamyl ), parathion  
 (parathion ), parathion -methyl (parathion-methyl ),  
 permethrin (permethrin ), phenthoate (phenthoate ), phoxim  
 (phoxim ), phorate (phorate ), phosalone (phosalone ),  
 phosmet (phosmet ), [hosufamidon ] (phosphamidon ) pirimor  
 (pirimicarb ), pirimiphos -methyl (pirimiphos-methyl ),  
 profenofos (profenofos ), pymetrozine (pymetrozine ),  
 pyraclofos (pyraclofos ), pyriproxyfen  
 (pyriproxyfen ), rotenone (rotenone ), sulprofos (sulprofos ),  
 silafluofen (silafluofen ), [supinosado ] (spinosad ), sulfo step

(profenofos)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclufos)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ロテノン(rotenone)、スルプロホス(sulprofos)、シラフルオフェン(silafluofen)、スピノサド(spinosad)、スルホテップ(sulfotep)、テブフェノジド(tebfenozide)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、テフルトリン(tefluthrin)、テルブホス(terbufos)、テトラクロロビンホス(tetrachlorvinphos)、チオジカルブ(thiodicarb)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオファノックス(thiofanox)、チオメトン(thiometon)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、トラロメスリン(tralomethrin)、トリクロルホン(trichlorfon)、トリアズロン(triazuron)、トリフルムロン(triflumuron)及びバミドチオン(vamidothion)等。

## 【0268】

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.005~50kg程度が適当である。

## 【0269】

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。

但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。

なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

## 〔水和剤〕

(sulfotep), tebfenozide (tebfenozide), teflubenzuron (teflubenzuron), tefluthrin (tefluthrin), terbufos (terbufos), [tetorakurobinhosu] (tetrachlorvinphos), thiodicarb (thiodicarb), [chiametokisamu] (thiamethoxam), [chiofanokkusu] (thiofanox), thiomethon (thiometon), [torufenpirado] (tolfenpyrad), tralomethrin (tralomethrin), trichlorphon (trichlorfon), triazuron (triazuron), triflumuron (triflumuron) and vamidothion (vamidothion) etc.

## 【0268】

As for application dose of the compound of this invention there is a difference depending upon the application locale, application time, application method, cultivated crop etc, but generally per hectare (ha) 0.005 - 50 kg extent is suitable as amount of active ingredient.

## 【0269】

combination example of formulation when the compound of this invention is used next is shown.

However combination example of this invention is not something which is limited only these.

Furthermore, "part" means parts by weight in combination example below.

{ wettable }

本発明化合物	0.1~80部	
the compound of this invention	0.1 - 80 parts	
固体担体	5~98.9 部	
solid carrier	5 - 98.99 part	
界面活性剤	1~10部	
Boundary surfactant	1 - 100 part	
その他	0	5部
In addition	0	5 sections
れらる。		

* And others *.		
〔乳 剤〕		
{ emulsion }		
本発明化合物	0.1～30部	
the compound of this invention	0.1 - 30 sections	
液体担体	45～95部	
liquid carrier	45 - 95 sections	
界面活性剤	4.9～15部	
Boundary surfactant	4.9 - 15 sections	
その他	0	10部
In addition	0	10 part
る。		
*.		
〔懸濁剤〕		
{ suspension }		
本発明化合物	0.1～70部	
the compound of this invention	00.1700 part	
液体担体	15～98.89 部	
liquid carrier	15 - 98.89 sections	
界面活性剤	1～12部	
Boundary surfactant	1 - 12 sections	
その他	0.01	～30部
In addition	0. 01	- 30 sections
る。		

*.		
〔顆粒水和剤〕		
{ granule wettable }		
本発明化合物	0.1～90部	
the compound of this invention	0.1 - 90 sections	
固体担体	0～98.9 部	
solid carrier	0 - 98.99 part	
界面活性剤	1～20部	
Boundary surfactant	1 - 200 part	
その他	0～	10部
In addition	0 -	10 part
る。		
*.		
〔液 剤〕		
{ liquid }		
本発明化合物	0.01～70部	
the compound of this invention	0.01 - 70 sections	
液体担体	20～99.99 部	
liquid carrier	20 - 99.99 sections	
その他	0～	10部
In addition	0 -	100 part
る。		
*.		
〔粒 剤〕		



{granule }		
本発明化合物	0.01～80部	
the compound of this invention	0.01 - 80 parts	
固体担体	10～99.99 部	
solid carrier	10 - 99.99 sections	
その他	0	～10部
In addition	0	- 10 part
る。		
*.		
〔粉 剤〕		
{powder }		
本発明化合物	0.01～30部	
the compound of this invention	0.01 - 300 part	
固体担体	65～99.99 部	
solid carrier	65 - 99.99 sections	
その他	0～5部	
In addition	0 - 5 sections	

挙げられる。

【0270】

使用に際しては上記製剤を水で 1～10000 倍に希釈してまたは希釈せずに散布する。

【0271】

本発明化合物の施用方法としては、茎葉散布、土壌処理、種子消毒等が挙げられるが、通常当業者が利用する一般的な方法においても有効である。

【0272】

It is listed.

[0270]

With water diluting above-mentioned formulation in 1 - 10000 times at time of use, or without diluting scattering fabric it does.

[0271]

As application method of the compound of this invention , you can list foliage spreading , soil treatment , seed disinfection etc, but regarding to general method which usually person skilled in the art utilizes it is effective.

[0272]

## 【実施例】

本発明化合物の合成例を実施例として以下に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

【0273】

## 〔実施例 1〕

メチル 2-(1,3-ジメチル-4-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)ピラゾール-5-イル)酢酸(本発明化合物 I-1)の合成

メチル 2-(1,3-ジメチル-4-(((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ピラゾール-5-イル)酢酸 512mg(2mmol)を 2ml の N,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これにフェナシルブロマイド 398mg(2mmol)を加えた。

80 deg C で 3 時間加熱撹拌した後、反応混合物に水 10ml および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 2.5ml を加え酢酸エチルにて抽出した。

有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製し、さらにジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(1,3-ジメチル-4-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)ピラゾール-5-イル)酢酸 350mg を無色結晶として得た。

## [Working Example(s)]

It shows below, with synthesis example of the compound of this invention as Working Example , but the this invention is not something which is limited in only these.

[0273]

## [Working Example 1]

Synthesis of methyl 2- (1 and 3 -dimethyl -4- (aza (5 -methyl -4- phenyl -2, 5- [chiazoriniriden ] ) methyl ) pyrazole -5-yl ) acetic acid (the compound of this invention I-1 )

methyl 2- (1 and 3 -dimethyl -4- (methylamino ) thioxo methyl ) amino ) pyrazole -5-yl ) acetic acid 512mg (2 mmol ) was melted in N, N- dimethylformamide of 2 ml , phenacyl bromide 398mg (2 mmol ) was added to this.

With 80 deg C 3 hours heat and stir after doing, in reaction mixture it extracted with the ethylacetate including water 10 ml and 1 normal sodium hydroxide water solution 2.5ml .

organic layer after drying, was filtered with anhydrous magnesium sulfate , solvent under vacuum was removed.

residue which it acquires refining sushi, furthermore by washing with diisopropyl ether with silica gel column chromatography (chloroform ) it acquired methyl 2- (1 and 3 -dimethyl -4- (aza (5 -methyl -4- phenyl -2, 5- [chiazoriniriden ] ) methyl ) pyrazole -5-yl ) acetic acid 350mg of the objective as colorless crystal .

融点: 100-101°C

melting point :100-101\*

【実

施例2】

Truth

Shi Example 2 \*

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-1-ナフチル)酢酸(本発明化合物 II-1)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-1-ナフチル)酢酸 0.8g(2.65mmol)を 2ml のジオキサランに溶解し、これに 4-メチルフェニル 1-ブロモエチルケトン 0.66g(2.9mmol)を加えた。105 deg C で 3 時間加熱撹拌した後、溶媒を留去し、水 10ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製し、さらにジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ

jp8 roof \*\* jp11 ) -2, 5- [okisachioreniriden ] synthesis of methyl ) -1- naphthyl ) acetic acid (the compound of this invention II-1 )

methyl 2- (2 - (dimethylamino ) thioxo methyl ) amino ) -1- naphthylacetic acid 0.8g (2.65 mmol ) was melted in dioxane of 2 ml , 4 -methylphenyl 1- bromoethyl ketone 0.66g the(2.9 mmol ) was added to this. 3 hours heat and stir after doing, it removed solvent with 105 deg C, it extracted with ethylacetate including water 10 ml . organic layer after drying, was filtered with anhydrous magnesium sulfate , solvent under vacuum was removed. It acquired methyl 2- (2 - (aza (5 -methyl -4- (4 -methyl -phenyl ) - 2 and 5 - [okisachioreniriden ] ) methyl ) - 1 -naphthyl ) acetic acid 0.58g of objective it refined residue which it acquires with silica gel column chromatography

(5-メチル-4-(4-メチル-フェニル)-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-1-ナフチル)酢酸 0.58g を無色結晶として得た。融点:118-119 deg C〔実施例3〕メチル (4-(4-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-5-メチル-[1,3]-ジチオール-2-イリデンアミノ)-2,5-ジメチル-2H-ピラゾール-3-イル)-酢酸(本発明化合物III-1)の合成参考例9により得られた(4-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチル-アンモニウム 硫酸塩 1.61g(4.37mmol)およびメチル 1,3-ジメチル-4-アミノピラゾール-5-イル-酢酸 0.8g(4.37mmol)を1,2-ジクロロエタン 8ml に懸濁し、これにトリエチルアミン 0.89g(8.74mmol)を加えた。加熱還流長時間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル (4-(4-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-5-メチル-[1,3]-ジチオール-2-イリデンアミノ)-2,5-ジメチル-2H-ピラゾール-3-イル)-酢酸 0.7g を無色結晶として得た。)

【0274】

(chloroform), furthermore by washing with diisopropyl ether as colorless crystal. It acquired melting point :118-119 deg C {Working Example 3} methyl (4 - (4 - (2 and 6 -difluoro -phenyl) - 5 -methyl - [1 and 3] -dithiol -2- ylidene amino) - 2 and 5 -dimethyl -2H-pyrazole -3- yl) -acetic acid with synthetic Reference Example 9 of(the compound of this invention III-1) (4 - (2 and 6 -difluoro -phenyl) - 5 -methyl - [1 and 3] dithiol -2- ylidene) -dimethyl -ammonium sulfate 1.61g (4.37 mmol) and in 1 and 2 -dichloroethane 8ml suspension to do methyl 1, 3- dimethyl -4- amino pyrazole -5-yl -acetic acid 0.8g (4.37 mmol), triethylamine 0.89g (8.74 mmol) was added to this. After heating and refluxing course time agitating, it extracted with ethylacetate including water. organic layer solvent after drying and under vacuum was removed with anhydrous magnesium sulfate. By washing residue which it acquires with diisopropyl ether methyl of the objective (4 - (4 - (2 and 6 -difluoro -phenyl) - 5 -methyl - [1 and 3] -dithiol -2- ylidene amino) - 2 and 5 -dimethyl -2H-pyrazole -3- yl) it acquired -acetic acid 0.7g as colorless crystal.)

【0274】

融点 ; m.p.103-106°C

melting point ; m.p.103 -106\*

〔実施例4〕

{ Working Example 4 }

リフルオロメチル-フェニル)-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-2-チオフエン)酢酸(本発明化合物II-18)の合成

参考例 10 により得られたメチル 3-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-2-チエニル)酢酸 290mg(1.14mmol)を1,4-ジオキサン 10ml に溶解し、これに 4-トリフルオロメチルフェニル 1-ブロモエチルケトン 0.33g(1.14mmol)を加えた。100 deg C で2時間加熱攪拌した後、溶媒を留去し、水 10ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて精製することにより、目的のメチル 2-(3-(アザ(5-メチル-4-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-2-チオフエン)酢酸 260mg を無色結晶として得た。)

【0275】

jp9 fluoromethyl -phenyl) -2, 5- [okisachioreniriden]) synthesis of methyl) -2- thiophene) acetic acid (the compound of this invention II-18)

methyl 3- (2 - (dimethylamino) thioxo methyl) amino) -2- thienyl acetic acid 290mg (1.14 mmol) which is acquired with Reference Example 10 was melted in 1 and 4 -dioxane 10ml, 4 -trifluoromethyl phenyl 1- bromoethyl ketone 0.33g (1.14 mmol) was added to this. 2 hours heat and stir after doing, it removed solvent with 100 deg C, it extracted with ethylacetate including water 10 ml. ethyl acetate layer solvent after drying and under vacuum was removed with anhydrous sodium sulfate. By refining residue which it acquires with silica gel column chromatography (n- hexane :ethylacetate =5:1), it acquired methyl 2- (3 - (aza (5 -methyl -4- (4 -trifluoromethyl -phenyl) - 2 and 5 - [okisachioreniriden]) methyl) - 2 -thiophene) acetic acid 260mg of objective as colorless crystal.)

【0275】

融点 ; 92-93°C

melting point ;92- 93\*

[参考例1]

{Reference Example 1 }

#### -5-イル)マロン酸の合成

マロン酸ジメチル 7.9g(60mmol)を N,N-ジメチルホルムアミド 100ml に溶解し、これに無水炭酸カリウム 12.4g(90mmol)および 1,3-ジメチル-4-ニトロ-5-クロロピラゾール 5.3g(30mmol)を加え、100 deg C にて 5 時間撹拌した。

反応混合物を水 100ml に注ぎ、酢酸エチルにて抽出後、有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。

ろ過後、溶媒を留去して析出した結晶をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、ジメチル (1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル)マロン酸 3.9g を淡黄色油状物として得た。

#### - 5 -yl ) malonic acid synthesis

It melted dimethyl malonate 7.9g (60 mmol ) in N, N-dimethylformamide 100ml , to this 5 hours it agitated with 100 deg C including anhydrous potassium carbonate 12.4g (90 mmol ) and 1 and 3 -dimethyl -4- nitro -5-chloro pyrazole 5.3g (30 mm ol ).

You poured reaction mixture to water 100 ml , with ethylacetate after extracting, washed organic layer with water and and saturated saline dried with anhydrous magnesium sulfate .

After filtering, removing solvent , by washing crystal which it precipitated with diisopropyl ether , it acquired dimethyl (1 and 3 -dimethyl -4- nitro pyrazole -5-yl ) malonic acid 3.9g as the pale yellow oil .

融点: 78-79°C

melting point :78-79\*

[参

考例2]

Going/participating

Thought Example 2 \*

#### -イル-酢酸の合成

ジメチル (1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル)マロン酸 3.7g(13.7mmol)をジメチルスルホキシド 60ml に溶解し、これに無水塩化リチウム 1.16g(27.3mmo)および水 0.25g を加え、100 deg C にて 2 時間加熱撹拌した。

反応混合物を水 100ml に注ぎ酢酸エチルにて抽出後、有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。

ろ過後、溶媒を留去することによりメチル 1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル-酢酸 2.6g を淡黄色油状物として得た。

[0276]

[参考例 3]

メチル 2-(1,3-ジメチル-4-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ピラゾール-5-イル)酢酸の合成

#### -yl -acetic acid synthesis

It melted dimethyl (1 and 3 -dimethyl -4- nitro pyrazole -5-yl ) malonic acid 3.7g (13.7 mmol ) in dimethyl sulfoxide 60ml , 2 hours heating and stirring it made this with 100 deg C anhydrous lithium chloride 1.16g (27.3 mmo ) and including water 0.25 g.

You poured reaction mixture to water 100 ml and with ethylacetate after extracting, washed organic layer with water and and saturated saline dried with anhydrous magnesium sulfate .

After filtering, by removing solvent it acquired methyl 1, 3-dimethyl -4- nitro pyrazole -5-yl -acetic acid 2.6g as the pale yellow oil .

[0276]

{Reference Example 3 }

Synthesis of methyl 2- (1 and 3 -dimethyl -4- (methylamino ) thioxo methyl ) amino ) pyrazole -5-yl ) acetic acid

メチル 1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル-酢酸 1.8g(8.5mmol)をメタノール 10ml に溶解し、これに 5%パラジウム-活性炭 0.1g を加えた後、水素雰囲気下室温にて 3 時間攪拌した。

パラジウム-活性炭をろ別後、減圧下メタノールを留去することによりメチル 1,3-ジメチル-4-アミノピラゾール-5-イル-酢酸 1.1g を淡黄色油状物として得た。

【0277】

続いて、得られたメチル 1,3-ジメチル-4-アミノピラゾール-5-イル-酢酸 1g(5.5mmol)を無水テトラヒドロフラン 10ml に溶解し、これにイソチオシアン酸メチル 0.4g(5.5mmol)およびトリエチルアミン 0.56g(5.5mmol)を加え、室温にて攪拌した。

96 時間後、減圧下溶媒を留去し、得られた反応混合物に水 10ml を加え酢酸エチルにて抽出した。

有機層を 1N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。

ろ過後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルの混合溶媒にて洗浄することによりメチル 2-(1,3-ジメチル-4-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ピラゾール-5-イル)酢酸 1.1g を無色結晶として得た。

【0278】

It melted methyl 1, 3- dimethyl -4- nitro pyrazole -5-yl -acetic acid 1.8g (8.5 mmol ) in methanol 10ml , after adding 5% palladium -activated carbon 0.1 g to this, 3 hours it agitated with room temperature under hydrogen atmosphere .

It acquired methyl 1, 3- dimethyl -4- amino pyrazole -5-yl -acetic acid 1.1g palladium -activated carbon by removing methanol after filtering and under vacuum as pale yellow oil .

[0277]

Consequently, it melted methyl 1, 3- dimethyl -4- amino pyrazole -5-yl -acetic acid 1g (5.5 mmol ) which is acquired in anhydrous tetrahydrofuran 10ml , in this it agitated with room temperature isothiocyanate methyl 0.4g (5.5 mmol ) and including the triethylamine 0.56g (5.5 mmol ) .

It removed and under vacuum solvent of 96 hours , later in the reaction mixture which is acquired it extracted with ethylacetate including the water 10 ml .

After washing organic layer with 1 N hydrochloric acid , it dried with anhydrous magnesium sulfate .

It acquired methyl 2- (1 and 3 -dimethyl -4- (methylamino ) thioxo methyl ) amino ) pyrazole -5-yl ) acetic acid 1.1g it removed solvent after filtering and under vacuum residue which is acquired, by washing with mixed solvent of diethyl ether and diisopropyl ether as colorless crystal .

[0278]

融点; 138-139°C

melting point ;138-139\*

【参考例4】

{Reference Example 4 }

ン酸エステル合成

2-ニトロ-1-ナフチルアルコール 5g(26.44mmol)を塩化メチレン 60ml に溶解し 0 deg C に冷却した。

これに、ピリジン 2.54g(32.15mmol)および無水トリフルオロメタンスルホン酸 8.21g(29.1mmol)を加え、4 時間 30 分攪拌した。

反応混合物を氷水に注ぎ、クロロホルムにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することで、2-ニトロ-1-ナフチル トリフルオロメタンスルホン酸エステルを褐色油状物 6.1g を得た。

Synthesis of [n ] acid ester

2 -nitro -1- naphthyl alcohol 5g it melted (26.44 mmol ) in methylene chloride 60ml and cooled in 0 deg C.

To this, equivalent of 4 hours 30 it agitated pyridine 2.54g (32.15 mmol ) and including anhydrous trifluoromethane sulfonic acid 8.21g (29.1 mmol ) .

You poured reaction mixture to ice water , with chloroform after extracting, dried with anhydrous sodium sulfate , by fact that solvent after filtering and under vacuum is removed, 2 -nitro -1- naphthyl trifluoromethanesulfonic acid ester you acquired brown oil 6.1g.

【0279】

〔参考例 5〕

ジメチル 2-(2-ニトロ-1-ナフチル)マロン酸の合成

ヘキサンにて洗浄した水素化ナトリウム 2.31g(52.9mmol)を N,N-ジメチルホルムアミド 46ml に懸濁し、マロン酸ジメチル 9.14g(69.24mmol)を N,N-ジメチルホルムアミド 20ml に溶解したものを加えた。

室温にて1時間30分攪拌した後、N,N-ジメチルホルムアミド 20ml に溶解した 2-ニトロ-1-ナフチルトリフルオロメタンスルホン酸エステルを加えさらに室温にて、14時間攪拌した。

反応混合物を1規定塩酸および氷水の混合溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、ろ過後、溶媒を留去することにより、目的のジメチル 2-(2-ニトロ-1-ナフチル)マロン酸 12.5g を粗生成物として得た。

【0279】

{Reference Example 5 }

Synthesis of dimethyl 2- (2 -nitro -1- naphthyl ) malonic acid

sodium hydride 2.31 g (52.9 mmol ) which was washed with hexane suspension was done in N, N- dimethylformamide 46ml , those which melt dimethyl malonate 9.14g (69.24 mmol ) in N, N- dimethylformamide 20ml were added.

Furthermore with room temperature , 14 hours it agitated equivalent of 1 hour 30 after agitating, including 2 -nitro -1- naphthyl trifluoromethanesulfonic acid ester where it melts in N, N- dimethylformamide 20ml with room temperature .

You poured reaction mixture to 1 normal hydrochloric acid and mixed solution of ice water , extracted with ethylacetate .

It acquired dimethyl 2- (2 -nitro -1- naphthyl ) malonic acid 12.5g of objective it dried ethyl acetate layer with anhydrous sodium sulfate , after filtering, by removing solvent , as crude product .

〔参考例6〕

{Reference Example 6 }

メチル 2-

methyl 2-

2

—

2

ナ

[na ]

フチ

[fuchi ]

ル

jp11

酢酸の合成

Synthesis of acetic acid

ル)マロン酸 12.5g(41.25mmol)を酢酸 30ml に溶解し、これに塩酸 30ml を加え、110 deg C にて 8 時間加熱攪拌した。

反応混合物を冷却し、析出した結晶をろしゆすることにより、2-(2-ニトロ-1-ナフチル)酢酸 4.2g を淡黄色結晶として得た。

【0280】

引き続き得られた、2-(2-ニトロ-1-ナフチル)酢酸をメタノール 60ml によ溶解しこれに、濃硫酸 1.2g を加え、加熱還流した。

2 時間後、溶媒を留去し、水 100ml を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、濾過紙、減圧下溶媒を留去した。

得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィ(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)にて精製す

It melted jp11 ) malonic acid 12.5g (41.25 mmol ) in acetic acid 30ml , 8 -hour heating and stirring it made this with 110 deg C including hydrochloric acid 30ml .

2 - it acquired (2 -nitro -1- naphthyl ) acetic acid 4.2g it cooled reaction mixture , by \* palpusdoing crystal which was precipitated, as pale yellow crystal .

【0280】

It acquired continuously, 2 - (2 -nitro -1- naphthyl ) acetic acid it melted in methanol 60ml and in this, heating and refluxing it did including concentrated sulfuric acid 1.2g.

2 hours later, it removed solvent , after adding water 100 ml , it extracted with ethylacetate .

ethyl acetate layer was washed with saturated aqueous sodium bicarbonate solution and saline , solvent after drying and under filtration paper , vacuum was removed with anhydrous sodium sulfate .

By refining residue which it acquires, with silica gel column chromatography (ethylacetate :n- hexane =1:5 ) , itacquired

ることにより、目的のメチル 2-(2-ニトロ-1-ナフチル)酢酸 2.6g を淡黄色結晶として得た。

[0281]

methyl 2- (2 -nitro -1- naphthyl ) acetic acid 2.6g of objective as pale yellow crystal .

[0281]

	〔参考例7〕		
	{Reference Example 7 }		
メチル	2ー(2ーアミ	ノー1ーナ	フチル)酢酸の合成
methyl	2 - [ami ]2 -	[no ] - 1 - [na ]	Synthesis of butyl ) acetic acid

g(13.3mmol)をメタノール 30ml に溶解し、これに 5%パラジウム-活性炭 0.1g を加えた後、水素雰囲気下室温にて 4 時間 30 分攪拌した。

パラジウム-活性炭をろ別後、減圧下メタノールを留去することによりメチル 2-(2-アミノ-1-ナフチル)酢酸 2.34g を褐色油状物として得た。

[0282]

〔参考例 8〕

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキシメチル)アミノ)-1-ナフチル)酢酸の合成チオカルボニルジイミダゾール 1.68g(9.4mmol)を N,N-ジメチルホルムアミド 10ml に溶解し、5 deg C に冷却した。続いて、メチル 2-(2-アミノ-1-ナフチル)酢酸 1.94g(9mmol)を加え、室温にて、1 時間 30 分攪拌した。さらに、40%ジメチルアミン水溶液 1.22g(10.8mmol)を加え、さらに 1 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた反応混合物に水 10ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルの混合溶媒にて洗浄することによりメチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキシメチル)アミノ)-1-ナフチル)酢酸 2g を黒色結晶として得た。))

[0283]

〔参考例 9〕

(4-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチル-アンモニウム 硫酸塩の合成

ジメチルジチオカルバミン酸ナトリウム 2 水和物 7.93g(44.33mmol)をアセトニトリル 80ml に懸濁し、これに 1-ブロモ-1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-プロパン-2-オン 10.03g(40.3mmol)を加え、室温

It melted g (13.3 mmol ) in methanol 30ml , after adding 5% palladium -activated carbon 0.1 g to this, equivalent of 4 hours 30 it agitated with room temperature under hydrogen atmosphere .

It acquired methyl 2- (2 -amino -1- naphthyl ) acetic acid 2.34g palladium -activated carbon by removing methanol after filtering and under vacuum as brown oil .

[0282]

{Reference Example 8 }

It melted synthetic thiocarbonyl diimidazole 1.68g (9.4 mmol ) of methyl 2- (2 - (dimethylamino ) thioxo methyl ) amino ) -1- naphthylacetic acid in N, N- dimethylformamide 10ml , cooled in 5 deg C. Consequently, with room temperature , equivalent of 1 hour 30 it agitated including methyl 2- (2 -amino -1- naphthyl ) acetic acid 1.94g (9 mmol ). Furthermore, furthermore 1 hour it agitated including 40% dimethyl amine water solution 1.22g (10.8 mmol ). It removed solvent under vacuum , in reaction mixture which is acquired it extracted with ethylacetate including water 10 ml . After washing organic layer with 1 N hydrochloric acid , it dried with anhydrous magnesium sulfate . It acquired methyl 2- (2 - (dimethylamino ) thioxo methyl ) amino ) -1- naphthylacetic acid 2g it removed solvent after filtering and under vacuum residue which is acquired, by washing with mixed solvent of diethyl ether and diisopropyl ether as black crystal . )

[0283]

{Reference Example 9 }

(4 - (2 and 6 -difluoro -phenyl ) - 5 -methyl - [1 and 3] dithiol -2- ylidene ) -dimethyl -ammonium sulfate synthesis

Suspension it did sodium dimethyl dithiocarbamate dihydrate 7.93g (44.33 mmol ) in acetonitrile 80ml , to this 1 hour it agitated with room temperature 1 -bromo -1- (2 and 6 -difluoro -phenyl ) -propane -2- on 10.03g including (40.3

にて1時間攪拌した。

減圧下溶媒を留去し、水 100ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。

有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。

引き続き、残渣に濃硫酸 13ml を加え室温にて1時間攪拌した。

反応混合物に酢酸エチル 1.5l を注ぎ、析出した結晶をろ取することにより、(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチル-アンモニウム硫酸塩 10g を無色結晶として得た。

【0284】

〔参考例 10〕

メチル 3-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-2-チエニル酢酸の合成 2-クロロ-3-ニトロチオフェン 3g(18.34mmol)、マロン酸ジメチル 3.63g(27.51mmol)、炭酸カリウム 4.97g(36mmol)および N,N-ジメチルホルムアミド 30ml を混合し、室温にて16時間攪拌した。反応混合物を1規定塩酸水溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、ジメチル 2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)マロン酸を得た。)

【0285】

得られたジメチル 2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)マロン酸 0.46g(1.78mmol)を酢酸 2ml に溶解し濃塩酸 2ml を加え 100 deg C にて1時間加熱攪拌した。

反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することで、2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)酢酸 320mg を得た。

【0286】

得られた 2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)酢酸 320mg(1.75mmol)をメタノール 5ml に溶解し、これに濃硫酸 1 滴を加えた後、還流下1時間攪拌した。

減圧下メタノールを留去し、水を加え酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、

mmol ) .

It removed solvent under vacuum , it extracted with ethylacetate including water 100 ml .

organic layer was washed with water and saturated saline , solvent afterdrying and under vacuum was removed with anhydrous sodium sulfate .

Continuously, to residue 1 hour it agitated with room temperature including concentrated sulfuric acid 13ml .

(4 - (2 and 6 -difluoro -phenyl ) - 5 -methyl - [1 and 3] dithiol -2- ylidene ) You acquired -dimethyl -ammonium sulfate 10g you poured ethylacetate 1.5l to reaction mixture , by filtering crystal which was precipitated, as colorless crystal .

【0284】

{Reference Example 10 }

Synthesis of methyl 3- (2 - (dimethylamino ) thioxo methyl ) amino ) -2- thienyl acetic acid 2 -chloro -3- nitro thiophene 3g (18.34 mmol ) , dimethyl malonate 3.63g (27.51 mmol ) , it mixed potassium carbonate 4.97g (36 mmol ) and N, N- dimethylformamide 30ml , 16 hours agitated with room temperature . You poured reaction mixture to 1 normal hydrochloric acid solution , extracted with ethylacetate . ethyl acetate layer was washed with saturated saline , dimethyl 2- (3 -nitro thiophene -2- yl ) malonic acid was acquiredby removing solvent after drying and under vacuum with anhydrous sodium sulfate . )

【0285】

It melted dimethyl 2- (3 -nitro thiophene -2- yl ) malonic acid 0.46g (1.78 mmol ) which it acquires in acetic acid 2ml and 1 hour heating and stirring it did with 100 deg C including concentrated hydrochloric acid 2ml .

In reaction mixture it extracted with ethylacetate including water.

ethyl acetate layer by fact that solvent after drying and under vacuum is removed with anhydrous sodium sulfate , 2 - (3 -nitro thiophene -2- yl ) acetic acid 320mg was acquired.

【0286】

2 it acquires - it melted (3 -nitro thiophene -2- yl ) acetic acid 320mg (1.75 mmol ) in methanol 5ml , after adding concentrated sulfuric acid 1 drop to this, 1 hour under reflux it agitated.

It removed methanol under vacuum , it extracted with ethylacetate including water.

ethyl acetate layer was washed with saturated aqueous sodium bicarbonate solution , by fact that solvent afterdrying and



減圧下溶媒を留去することで、メチル 2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)酢酸 300mg を得た。

【0287】

得られたメチル 2-(3-ニトロチオフェン-2-イル)酢酸 300mg(1.52mmol)をメタノール 15ml に溶解し、塩化第一銅 0.45g(4.5mmol)および水素化ホウ素カリウム 0.54g(10mmol)を加え、室温にて 15 分間撹拌した。

不溶物を濾別し、ろ液を減圧下濃縮した後、水を加え酢酸エチルにて抽出した。

酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。

得られた残渣を 0 deg C にて 1,1-チオカルボニルジイミダゾール 0.29g(1.62mmol)の N,N-ジメチルホルムアミド 5ml 溶液に加え、室温にて 45 分間撹拌した。

次いで、反応混合物に 50%メチルアミン水溶液 0.27g を加え、室温にてさらに 30 分間撹拌した。

反応混合物を 1 規定塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出後、酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することで、メチル 2-(3-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-2-チエニル)酢酸 290mg を得た。

【0288】

次にこれらの方法に準じて製造した一般式(1)の化合物の物性値等を第 6 表から第 8 表に示す。

なお、表中の略号は、前述の通りであり、Het1 から Het21 および Ta1 から Ta4 は以下のものを表す。

【0289】

【化 74】

under vacuum is removed with anhydrous sodium sulfate , methyl 2- (3 -nitro thiophene -2- yl ) acetic acid 300mg was acquired.

[0287]

It melted methyl 2- (3 -nitro thiophene -2- yl ) acetic acid 300mg (1.52 mmol ) which it acquires in methanol 15ml , 15 min it agitated with room temperature chloride first dong 0.45g (4.5 mmol ) and including potassium borohydride 0.54g (10 mmol ).

It filtered insoluble matter , it extracted with ethylacetate after under the vacuum concentrating filtrate , including water.

ethyl acetate layer solvent after drying and under vacuum was removed with anhydrous sodium sulfate .

residue which it acquires with 0 deg C 45 minute it agitated with the room temperature 1 and 1 -thiocarbonyl diimidazole 0.29g in addition to N, N- dimethylformamide 5ml solution of (1.62 mmol ).

Next, to reaction mixture furthermore 30 minute it agitated with room temperature including 50% methylamine aqueous solution 0.27g.

reaction mixture was poured to 1 normal hydrochloric acid , with ethylacetate after extracting, the ethyl acetate layer was dried with anhydrous sodium sulfate , by fact that solvent under the vacuum is removed, methyl 2- (3 - (dimethylamino ) thioxo methyl ) amino ) -2- thienyl acetic acid 290mg was acquired. )

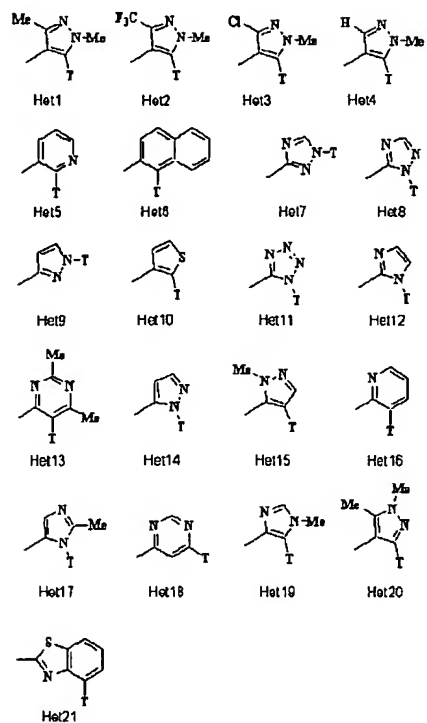
[0288]

Next property value etc of compound of General Formula (1) which is produced according to these method from Table 6 is shown in Table 8 .

Furthermore, as for code of in the table , with aforementioned sort, from Het1 as for Ta4 those below are displayed from Het21 and Ta1.

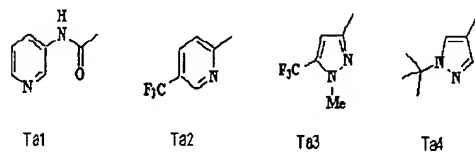
[0289]

[Chemical Formula 74]



[0290]

[化 75]

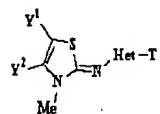


[0291]

[第 6 表]

[0292]

[化 76]



[0293]

[表 6]

[0290]

[Chemical Formula 75]

[0291]

{ Table 6 }

[0292]

[Chemical Formula 76]

[0293]

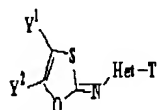
[Table 6]

No.	Y1	Y2	Het	T	物性(m.p.等)
No.	Y1	Y2	Het	T	property (m.p. etc)

I-1 H		Ph			Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.100-101°C
I-1 H		Ph			Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.100-101*
I-2 H		2,6-F2-Ph			Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.146-147°C
I-2 H		2 and 6 -F22- h			Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.146-147*
I-3 H		Ph			Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	nD20.21.5244
I-3 H		Ph			Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	nD20.21.5244
I-4 H		2,6-F2-Ph			Het6	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.131-132°C
I-4 H		2 and 6 -F22- h			Het6	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.131-132*
I-5 H		Ta2			Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5161
I-5 H		Ta2			Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5161
〔第7〕	表	〕					
7th	Chart	)					

【0294】

[0294]



【化 77】

[Chemical Formula 77]

【0295】

[0295]

【表 7】

[Table 7]

No. Y<sup>1</sup> Y<sup>2</sup> Het T 物性(m.p.等)No. Y<sup>1</sup> Y<sup>2</sup> Het T property (m.p. etc)II-1 Me 4-Me-Ph Het6 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.118-119 deg CII-1 Me 4- Me-Ph Het6 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.118-119 deg CII-2 Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Het6 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.143.5-144 deg CII-2 Me 4- CF<sub>3</sub>-Ph Het6 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.143.5-144 deg CII-3 Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Het1 CH<sub>2</sub>COOMeII-3 Me 4- CF<sub>3</sub>-Ph Het1

m.p.133.5-134 deg C

II-4 Me 4-Me-Ph Het1 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.74-76 deg CII-5 Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Het3 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.100.5-101 deg CII-6 Me 4-Me-Ph Het3 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.80-83 deg CII-7 Me 2-F-4-CF<sub>3</sub>-Ph Het3 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.88-89 deg CII-8 Me 4-Me-Ph Het3 CH<sub>2</sub>CONHMe m.p.166-167 deg CII-9 Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Het2 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.118.5-119.5 deg CII-10 Me 4-Me-Ph Het2 CH<sub>2</sub>COOMe oilII-11 Me 4-CF<sub>3</sub>-Ph Het4 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.164-165 deg CII-12 Me 4-Me-Ph Het4 CH<sub>2</sub>COOMe m.p.113-114 deg CCH<sub>2</sub><sub>2</sub>COOMe m.p.133.5-134 deg C

II-4 Me 4-Me-Ph Het1 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.74-76 deg C

II-5 Me 4-CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph Het3 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.100.5-101 deg C

II-6 Me 4-Me-Ph Het3 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.80-83 deg C

II-7 Me 2-F-4-CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph Het3 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.88-89 deg C

II-8 Me 4-Me-Ph Het3 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;CONHMe m.p.166-167 deg C

II-9 Me 4-CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph Het2 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.118.5-119.5 deg C

II-10 Me 4-Me-Ph Het2 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe oil

II-11 Me 4-CF&lt;sub&gt;3&lt;/sub&gt;-Ph Het4 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.164-165 deg C

II-12 Me 4-Me-Ph Het4 CH&lt;sub&gt;2&lt;/sub&gt;COOMe m.p.113-114 deg C

II-13	Me	4-Me-Ph		Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-13	Me	4-Me-Ph		Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-14	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-14	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het5	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-15	Me	4-Me-Ph		Het7	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.158-160°C
II-15	Me	4-Me-Ph		Het7	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.158-160*
II-16	Me	4-Me-Ph		Het8	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.127-129°C
II-16	Me	4-Me-Ph		Het8	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.127-129*
II-17	Me	4-Me-Ph		Het9	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.143-145°C
II-17	Me	4-Me-Ph		Het9	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.143-145*
II-18	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.92-93°C
II-18	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.92-93*
II-19	Me	Tal		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.89-90°C

II-19	Me	Tal		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.89-90*
II-20	Me	PhNHC(O)		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.69-70°C
II-20	Me	PhNHC (O )		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.69-70*
II-21	Me	4-t-Bu-Ph		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5153
II-21	Me	4 -t-Bu-Ph		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5153
II-22	Me	4-Cl-Ph		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD22.01.5473
II-22	Me	4 -Cl-Ph		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD22.01.5473
II-23	Me	2-F-4-CF <sub>3</sub> -P		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5182
II-23	Me	2 -F-4- CF <sub>3</sub> - P		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5182
II-24	Me	3-F-4-CF <sub>3</sub> -P		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5190
II-24	Me	3 -F-4- CF <sub>3</sub> - P		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.41.5190
II-25	Me	4-Cl-Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.90-93°C
II-25	Me	4 -Cl-Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.90-93*
II-26	Me	4-t-Bu-Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD23.91.4298
II-26	Me	4 -t-Bu-Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD23.91.4298
II-27	Me	3,4-F <sub>2</sub> -Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.81.4688
II-27	Me	3 and 4 -F <sub>2</sub> - Ph		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.81.4688
II-28	Me	3-F-4-CF <sub>3</sub> -P		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.116-119°C
II-28	Me	3 -F-4- CF <sub>3</sub> - P		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.116-119*
II-29	Me	4-Me-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.103-103.5°C
II-29	Me	4 -Me-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.103 -103 .5*
II-30	Me	4-Cl-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.95.5-96°C
II-30	Me	4 -Cl-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.95.5-96*
II-31	Me	4-t-Bu-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD24.01.5037

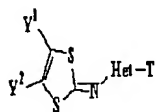
II-31	Me	4 -t-Bu-Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD24.01.5037
II-32	Me	3,4-F <sub>2</sub> -Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.69-70°C
II-32	Me	3 and 4 -F <sub>2</sub> - Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.69-70*
II-33	Me	2-F-4-CF <sub>3</sub> -P		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD23.71.4419
II-33	Me	2 -F-4- CF <sub>3</sub> - P		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD23.71.4419
II-34	Me	3-F-4-CF <sub>3</sub> -P		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.118.5-119°C
II-34	Me	3 -F-4- CF <sub>3</sub> - P		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.118.5-119*
II-35	Me	4-Me-Ph		Het11	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.129-131°C
II-35	Me	4 -Me-Ph		Het11	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.129-131*
II-36	Me	4-Me-Ph		Het12	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.140.5-141.5°C
II-36	Me	4 -Me-Ph		Het12	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.140.5-141.5*
II-37	Me	4-Me-Ph		Het13	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.158-160°C
II-37	Me	4 -Me-Ph		Het13	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.158-160*
II-38	Me	4-Me-Ph		Het14	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-38	Me	4 -Me-Ph		Het14	CH <sub>2</sub> COOMe	oil
II-39	Me	Ta <sub>2</sub>		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.51.5344
II-39	Me	Ta <sub>2</sub>		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.51.5344
II-40	Me	Ta <sub>2</sub>		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.51.5304
II-40	Me	Ta <sub>2</sub>		Het2	CH <sub>2</sub> COOMe	nD21.51.5304
II-41	Me	Ta <sub>2</sub>		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.157-158°C
II-41	Me	Ta <sub>2</sub>		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.157-158*
II-42	Me	PhNHC(O)		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.100-101°C
II-42	Me	PhNHC (O )		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.100-101*
II-43	Me	Ta <sub>1</sub>		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.134-135°C

II-43	Me	Ta1		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.134-135*
II-44	Me	4-Me-Ph		Het15	CH <sub>2</sub> COOEt	m.p.109-111°C
II-44	Me	4 -Me-Ph		Het15	CH <sub>2</sub> COOEt	m.p.109-111*
II-45	Me	4-Me-Ph		Het15	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.129-131°C
II-45	Me	4 -Me-Ph		Het15	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.129-131*
II-46	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.113.5-114.5°C
II-46	Me	4 -CF <sub>3</sub> - Ph		Het10	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.113.5-114.5*
II-47	Me	4-Me-Ph		Het16	OCOOMe	m.p.149.5-150.5°C
II-47	Me	4 -Me-Ph		Het16	OCOOMe	m.p.149.5-150.5*
II-48	Me	4-Me-Ph		Het17	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.167-170°C
II-48	Me	4 -Me-Ph		Het17	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.167-170*
II-49	Me	4-Me-Ph		Het18	OCH <sub>2</sub> COOM	m.p.182-184°C
II-49	Me	4 -Me-Ph		Het18	OCH <sub>2</sub> COOM	m.p.182-184*
II-50	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het13	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.180-181°C
II-50	Me	4 -CF <sub>3</sub> - Ph		Het13	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.180-181*
II-51	Me	4-Me-Ph		Het19	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.166-167°C
II-51	Me	4 -Me-Ph		Het19	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.166-167*
II-52	Me	4-Me-Ph		Het19	CH <sub>2</sub> COOH	m.p.171-175°C
II-52	Me	4 -Me-Ph		Het19	CH <sub>2</sub> COOH	m.p.171-175*
II-53	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph		Het11	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.165-166°C
II-53	Me	4 -CF <sub>3</sub> - Ph		Het11	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.165-166*
II-54	Me	4-Me-Ph		Het20	CH <sub>2</sub> COOMe oil contains 50% of II-6	
II-54	Me	4 -Me-Ph		Het20	CH <sub>2</sub> COOMe oil contains 50% of II-6	
II-55	Me	Ta4		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD22.61.5440

II-55	Me	Ta4		Het3	CH <sub>2</sub> COOMe	nD22.61.5440
II-56	Me	4-Me-Ph		Het21	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.184-186°C
II-56	Me	4 -Me-Ph		Het21	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.184-186*
	〔第 表〕 Chart)					

【0296】

[0296]



【化 78】

[Chemical Formula 78]

【0297】

[0297]

【表 8】

[Table 8]

No.	Y1	Y2		Het	T	物性(m.p.等)
No.	Y1	Y2		Het	T	Physical properties (property p. etc)
III-1	Me	2,6-F2-Ph		Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.103-106°C
III-1	Me	2 and 6 -F2- Ph		Het1	CH <sub>2</sub> COOMe	m.p.103 -106*

次に、本発明化合物を有効成分とする農園芸用殺菌剤の製剤例を具体的に示すが、これらのみに限定されるものではない。

Next, Formulation Example of horticultural microbicide which designates the compound of this invention as active ingredient is shown concretely, but it is not something which is limited in only these.

なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

Furthermore, "part" means parts by weight in Formulation Example below.

〔製剤例1〕 乳剤		
{Formulation Example 1 } emulsion		
本発明化合物No. I-1		20部
the compound of this invention no.I-1		20 sections
メチルナフタレン		55部
methyl naphthalene		55 sections



シクロヘキサノン		20部
cyclohexanone		20 sections
ソルポール2680		5部
Sorpol 2680		5 sections

合物:東邦化学工業(株)商品名)

compound :Toho Chemical Industry Co., Ltd. tradename )

以下を均一に混合して乳剤とする。

Mixing below to uniform , it makes emulsion .

使用に際しては上記乳剤を 50~20000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50kg になるように散布する。

Diluting above-mentioned emulsion in 50 - 20000 times at time of use, in order for amount of active ingredient to become per hectare 0.005~50kg , scattering fabric it does.

〔製剤例2〕 水和剤			
{Formulation Example 2 } wettable			
本発明化合物No. I-1		25部	
the compound of this invention no.I-1		25 sections	
パイロフィライト		66部	
pyrophyllite (DANA 71.2.1.1 )		66 sections	
ソルポール5039		4部	
Sorpol 5039		4 sections	
(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)			
(anionic surfactant :Toho Chemical Industry Co., Ltd. tradename )			
カープレックス#80D		3部	
Carplex #80 D		3 sections	
(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)			
(white carbon :Shionogi & Co. Ltd. (DB 69-054-0711 ) tradename )			
リグニンスルホン酸カルシウム		2部	
calcium lignin sulfonate		2 sections	
以上を均一に混合粉碎して水和剤と	す	る。	

mixing and pulverization doing above in uniform , wettable	It does	*	
--	---------	---	--

【0298】

使用に際しては上記水和剤を 50~20000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50kg になるように散布する。

[0298]

Diluting above-mentioned wettable in 50 - 20000 times at time of use, in order for amount of active ingredient to become per hectare 0.005~50kg , scattering fabric it does.

〔製剤例3〕 粉剤		
{Formulation Example 3 } powder		
本発明化合物No. I-1		3部
the compound of this invention no.I-1		3 sections
カープレックス#80D		0. 5部
Carplex #80 D		0.5 Section
(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)		
(white carbon :Shionogi & Co. Ltd. (DB 69-054-0711 ) tradename )		
カオリナイト		95部
kaolinite		95 sections
リン酸ジイソプロピル		1. 5部
diisopropyl phosphate		1.5 Section

記粉剤を有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50kg になるように散布する。

Description powder is done in order for amount of active ingredient to become the per hectare 0.005~50kg , scattering fabric .

〔製剤例4〕 粒剤		
{Formulation Example 4 } granule		
本発明化合物No. I-1		5部
the compound of this invention no.I-1		5 sections
ベントナイト		30部
bentonite (DANA 71.3.1a.1-2 )		30 sections
タルク		64部

talc		64 sections
リグニンスルホン酸カル	ウ	1部
lignin sulfonic acid cull	[u]	1 section

し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

It does, granulating does with extrusion type granulator , dries and makes granule .

使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50kg になるように散布する。

Above-mentioned granule in order for amount of active ingredient to become per hectare 0.005~50kg ,scattering fabric is done at time of use.

〔製剤例5〕フロアブル剤					
{Formulation Example 5 } flowable					
本発明化合物No. I-1			25部		
the compound of this invention no.I-1			25 sections		
ソルポール3353			5部		
Sorpol 3353			5 sections		
(非イオン性界面活性剤: 東邦化学工業(株)商品名)					
(nonionic surfactant :Toho Chemical Industry Co., Ltd. tradename )					
ルノックス1000C			0. 5部		
Runox 1000C			0.5 Section		
(陰イオン界面活性剤: 東邦化学工業(株)商品名				)	
anionic surfactant :Toho Chemical Industry Co., Ltd. tradename				)	
ゼンサンガム(天然高分子)			0. 2部		
xanthan gum (natural polymer )			0.2 Section		
安息香酸ソーダ			0. 4部		
sodium benzoate			0.4 Section		
プロピレングリコール			10部		
propylene glycol			10 sections		
水			58. 9部		

Water		58.9 part		
-------	--	-----------	--	--

解し、ついで本発明化合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。

After agitating well understanding, including the compound of this invention next, the wet milling doing with sand mill, you obtain flowable.

使用に際しては、上記フロアブル剤を 50~20000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50kg になるように散布する。

At time of use, diluting above-mentioned flowable in 50 - 20000times, in order for amount of active ingredient to become per hectare 0.005~50kg, scattering fabric it does.

〔製剤例6〕 粒状水和剤(ドライフロアブル剤)				
{ Formulation Example 6 } granular wettable (dry flowable)				
本発明化合物No. I-1 75部				
the compound of this invention no.I-1 75 section				
ハイテノールNE-15 5部				
Hitenol NE- 155 part				
(アニオン性界面活性剤: 第一工業製薬(株)商品名) バニレックスN 10部				
(anionic surfactant :Dai-Ichi Kogyo Seiyaku Co. Ltd. (DB 69-055-7798 ) tradename ) Vanilex N 10 part				
(アニオン性界面活性剤: 日本製紙(株)商品名) カープレックス#80D 10部				
(anionic surfactant :Nippon Paper Industries Co. Ltd. (DB 69-053-6628 ) tradename ) Carplex #80 D 10 part				
(ホワイトカーボン: 塩野義製薬(株)商品名)				
(white carbon :Shionogi & Co. Ltd. (DB 69-054-0711 ) tradename )				

し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。

It does, granulating does with extrusion type granulator, dries and makes dry flowable.

使用に際しては水で 50~20000 倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール当たり0.005~50kg になるように散布する。

With water diluting in 50 - 20000 times at time of use, in order for active ingredient to become per hectare 0.005~50kg, scattering fabric it does.

〔試験例〕 本発明に係る化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。

You explain concretely concerning usefulness of compound which relate to {Test Example} this invention, in Test Example below.

但し、これらのみに限定されるものではない。

However, it is not something which is limited in only these.

【0299】

[0299]

〔試験例1〕 コムギうどんこ病防除効果試験

{Test Example 1} wheat powdery mildew protective effect test

直径5.5cmのポットで育成した2.0~2.5葉期のコムギ(品種: 農林61号)に、本発明化合物乳剤を

In wheat (variety :Norin 61 number) of 2.0 - 2.5-leaf stage which were reared with pot of diameter 5.5cm, diluting the

水で希釈して 500ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20ml 散布した。

## 【0300】

散布 1 日後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の胞子を直接接種した。

その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

## 【0301】

## 【数 1】

防除価 =  $\{ 1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率}) \} \times 100$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本 発 明 化 合  
No.; II-3, II-5, II-7, II-9, II-11, II-13, II-14, II-17, II-18, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, II-26, II-27, II-28, II-30, II-31, II-32, II-33, II-34, II-41, II-54, III

compound of this invention emulsion with water, per pot 20ml scattering fabric it did reagent solution which you adjusted 500 ppm making use of the spray gun .

## [0300]

After scattering fabric 1 day , spore of wheat powdery mildew microbe (*Erysiphe graminis* ) was done the inoculation directly.

After that, you placed in greenhouse , you measured ratio which is occupied in inoculation leaf of diseased spot surface area which was formed after inoculation 7 day you calculated protection value in accordance with below-mentioned formula.

## [0301]

## [Mathematical Formula 1]

protection value =  $\{ 1 - (\text{treated plot diseased spot surface area ratio} / \text{untreated plot diseased spot surface area ratio} ) \} \times 100$

As a result, compound below showed above protection value 70.

〔試験例 2〕コムギ赤さび病防除効果試験

{ Test Example 2 } wheat red rust protective effect test

直径 5.5cm のポットで育成した 2.0~2.5 葉期のコムギ(品種:農林 61 号)に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20ml 散布した。

【0302】

散布 1 日後、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) の孢子懸濁液 ( $2 \times 10^5$  個/ml) を噴霧し、温度 20~25 deg C、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。

その後、温室に置き、接種 10 日後に形成された病斑面積を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

【0303】

【数 2】

防除価 =  $\{ 1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率}) \} \times 100$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本

発

明

No.; I-1, II-1, II-3, II-4, II-5, II-6, II-7, II-8, II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-16, II-18, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, II-26, II-27, II-28, II-29, II-31

In wheat (variety :Norin 61 number) of 2.0 - 2.5-leaf stage which were reared with pot of diameter 5.5cm , diluting the compound of this invention emulsion with water, per pot 20ml scattering fabric it did reagent solution which you adjusted 500 ppm making use of the spray gun .

[0302]

After scattering fabric 1 day , atomization it did condiospore suspension ( $2 \times 10^{5\text{<sup>5</sup>}}$ /ml ) of wheat red rust microbe (*Puccinia recondita* ), whole day and night inserted in inoculation box of temperature 20~25 deg C, humidity 95% or more .

After that, you placed in greenhouse , you measured diseased spot surface area which wasformed after inoculation 10 day, you calculated protection value in accordance withbelow-mentioned formula.

[0303]

[Mathematical Formula 2]

protection value =  $\{ 1 - (\text{treated plot diseased spot surface area ratio} / \text{untreated plot diseased spot surface area ratio} ) \} \times 100$

As a result, compound below showed above protection value 70.

## 〔試験例 3〕 コムギふ枯れ病防除試験

直径 5.5cm のポットで育成した 2.0~2.5 葉期のコムギ(品種:アルトリア)に、本発明化合物の乳剤を水で希釈して 500ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポットあたり 20ml 散布処理した。

## 【0304】

散布 1 日後、ふ枯れ病菌 (*Leptosphaera nodorum*) の孢子懸濁液 ( $2 \times 10^5$  個/ml) を噴霧し接種を行った。

接種を行ったコムギを温度 18~20 deg C、湿度 95% 以上の接種箱に 7~10 日間入れ発病を促進させた。

形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

## 【0305】

## 【数 3】

防除価 =  $\{ 1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率}) \} \times 100$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本

発

明

No.; I-1, II-3, II-4, II-5, II-6, II-7, II-8, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, II-26, II-27, II-28, II-29, II-30, II

{Test Example 3} wheat \* it withers, illness protection test

In wheat (variety :art rear ) of 2.0 - 2.5-leaf stage which were reared with pot of diameter 5.5cm , diluting emulsion of the compound of this invention with water, per pot 20ml scattering fabric it treated reagent solution which it manufactures in 500 ppm making use of spray gun .

## 【0304】

After scattering fabric 1 day , \* it withered and atomization did condiospore suspension ( $2 \times 10^5$  /ml ) of germ (*Leptosphaera nodorum* ) and did inoculation .

wheat which did inoculation 7 - 10 day inserting disease were promoted in inoculation box of temperature 18~20 deg C, humidity 95% or more .

Ratio which is occupied in inoculation leaf of diseased spot surface area which was formed was measured, protection value was calculated in accordance with below-mentioned formula.

## 【0305】

## [Mathematical Formula 3]

protection value =  $\{ 1 - (\text{treated plot diseased spot surface area ratio} / \text{untreated plot diseased spot surface area ratio} ) \} \times 100$

As a result, compound below showed above protection value 70.

## 〔試験例 4〕 キュウリべと病防除効果試験

直径 7cm のポットで育成した 1.5 葉期のキュウリ (品種:相模半白)に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20ml 散布した。

## 【0306】

散布 1 日後、キュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の孢子懸濁液 ( $2 \times 10^5$  個/ml) を噴霧し、温度 20~25 deg C、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。

## { Test Example 4 } cucumber downy mildew protective effect test

1.5 -leaf stage where it reared with pot of diameter 7cm in cucumber (variety :Sagamihara Hanshiro ), diluting the compound of this invention emulsion with water, per pot 20ml scattering fabric itdid reagent solution which it manufactures in 500 ppm making use of the spray gun .

## [0306]

After scattering fabric 1 day , atomization it did condiospore suspension ( $2 \times 10^5$  /ml ) of cucumber downy mildew microbe (*Pseudoperonospora cubensis* ), whole day and night inserted in inoculation box of temperature 20~25 deg C, humidity 95% or more .



その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

【0307】

【数 4】

防除価 =  $\{1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})\} \times 100$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

【0308】

本 発 明 化 合  
No.; II-4, II-5, II-6, II-7, II-8, II-11, II-12, II-13, II-14, II-18, II-21, II-25, II-26, II-28, II-29, II-30, II-31, II-32, II-33, II-34, II-37, II-38, II-41, II-46, II-4

After that, ratio which is occupied in inoculation leaf of diseased spot surface area which was formed after inoculation 7 day to every greenhouse, was measured, the protection value was calculated in accordance with below-mentioned formula.

[0307]

[Mathematical Formula 4]

protection value =  $\{1 - (\text{treated plot diseased spot surface area ratio} / \text{untreated plot diseased spot surface area ratio})\} \times 100$

As a result, compound below showed above protection value 70.

[0308]

【0309】

【発明の効果】

これらの本発明化合物は、優れた植物病害に対する防除作用を有し、作物に対しても安全である。

[0309]

[Effects of the Invention]

These the compound of this invention have prevention action for plant disease which is superior, it is safe vis-a-vis crop.



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**